

PCTWELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM
Internationales BüroINTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation ⁶ : C07D 261/04, 307/58, A01N 43/80, 43/08		A1	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 99/07688
			(43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 18. Februar 1999 (18.02.99)
(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP98/04636		28. D-67069 Ludwigshafen (DE). WALTER, Helmut [DE/DE]; Grünstadter Strasse 82, D-67283 Obrigheim (DE). WESTPHALEN, Karl-Otto [DE/DE]; Mausbergweg 58, D-67346 Speyer (DE).	
(22) Internationales Anmeldedatum: 23. Juli 1998 (23.07.98)		(74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGESELLSCHAFT; D-67056 Ludwigshafen (DE).	
(30) Prioritätsdaten: 197 34 201.9 7. August 1997 (07.08.97) DE		(81) Bestimmungsstaaten: AL, AU, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, GE, HU, ID, IL, JP, KR, KZ, LT, LV, MK, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, TR, UA, US, VN, eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).	
(71) Anmelder (<i>für alle Bestimmungsstaaten ausser US</i>): BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-67056 Ludwigshafen (DE).		Veröffentlicht <i>Mit internationalem Recherchenbericht.</i> <i>Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist; Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen eintreffen.</i>	
(72) Erfinder; und			
(75) Erfinder/Anmelder (<i>nur für US</i>): ENGEL, Stefan [DE/DE]; Koelerstrasse 8, D-55286 Wörrstadt (DE). RHEINHEIMER, Joachim [DE/DE]; Merziger Strasse 24, D-67063 Ludwigshafen (DE). BAUMANN, Ernst [DE/DE]; Falkenstrasse 6a, D-67373 Dudenhofen (DE). von DEYN, Wolfgang [DE/DE]; An der Bleiche 24, D-67435 Neustadt (DE). HILL, Regina, Luise [DE/DE]; Ziegelofenweg 40, D-67346 Speyer (DE). MAYER, Guido [DE/DE]; Gutleuthausstrasse 8, D-67433 Neustadt (DE). MISSLITZ, Ulf [DE/DE]; Mandelring 74, D-67433 Neustadt (DE). WAGNER, Oliver [DE/DE]; Rossinistrasse 7, D-67061 Ludwigshafen (DE). WITSCHEL, Matthias [DE/DE]; Wittelsbachstrasse 81, D-67061 Ludwigshafen (DE). OTTEN, Martina [DE/DE]; Gunterstrasse			
(54) Title: 2-BENZOYL-CYCLOHEXANE-1,3-DIONES			
(54) Bezeichnung: 2-BENZOYL-CYCLOHEXAN-1,3-DIONE			
(57) Abstract			
<p>The invention relates to substituted 2-benzoyl-cyclohexane-1,3-diones of formula (I), wherein the substituents have the following meaning: R¹, R² stand for hydrogen, mercapto, nitro, halogen, cyano, rhodanine, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆ halogen alkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkinyl, -OR³, -OCOR³, -OSO₂R³, -S(O)_nR³, SO₂OR³, -NR³SO₂R³ or -NR³COR³, wherein R³ can have different meanings; n represents 0, 1 or 2; Q stands for an optionally substituted two-position bonded cyclohexane-1,3-dion ring; X¹ stands for a straight-chain or branched C₁-C₆-alkylene, a C₂-C₆-alkenylene or a C₂-C₆-alkinylene chain, wherein the above-mentioned alkylenes, alkenylenes or alkinylenes radicals can be partially halogenated and/or carry one to three of the following groups: -OR⁴, -OCOR⁴, -OCONHR⁴ or -OSO₂R⁴, wherein R⁴ can have different meanings and the above-mentioned alkenylenes radicals in which the double bond is located in the alpha, beta position with respect to the phenyle ring are excluded and in which Het is linked to the double bond in the beta position; Het represents a three to six-membered, partially or fully saturated heterocyclic group or a three to six-membered heteroaromatic group with up to three heteroatoms selected from the nitrogen, oxygen or sulfur group, wherein the above-mentioned heterocyclic or heteroaromatic group can be partially or totally halogenated and/or R⁵ can be substituted; wherein R⁵ can have different meanings. The invention further relates to the agricultural use of the salts of said compounds, to a method and to the intermediate products for the production of compounds of formula (I), to the agents contained in said compounds, to the use of the compounds of formula (I) and to the agents containing said compounds used in the control of harmful plants.</p>			

(57) Zusammenfassung

Die vorliegende Anmeldung betrifft Substituierte 2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dione der Formel (I), in der die Substituenten folgende Bedeutung haben: R¹, R² Wasserstoff, Mercapto, Nitro, Halogen, Cyano, Rhodano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, -OR³, -OCOR³, -OSO₂R³, -S(O)_nR³, -SO₂OR³, -SO₂N(R³)₂, -NR³SO₂R³ oder -NR³COR³, worin R³ verschiedene Bedeutungen haben kann; n 0, 1 oder 2; Q ein gegebenenfalls substituierter, in 2-Stellung verknüpfter Cyclohexan-1,3-dion-Ring; X¹ eine geradkettige oder verzweigte C₁-C₆-Alkylen-, eine C₂-C₆-Alkenylen- oder eine C₂-C₆-Alkinylenkette, wobei die genannten Alkylen-, Alkenylen- oder Alkinylenreste partiell halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: -OR⁴, -OCOR⁴, -OCONHR⁴ oder -OSO₂R⁴; worin R⁴ verschiedene Bedeutungen haben kann und wobei die genannten Alkenylenreste ausgenommen sind, bei denen sich die Doppelbindung in alpha, beta-Position zum Phenylring befindet und bei denen Het über die beta-Position an die Doppelbindung gebunden ist; Het eine drei- bis sechsgliedrige, teilweise oder vollständig gesättigte, heterocyclische Gruppe oder eine drei- bis sechsgliedrige heteroaromatische Gruppe mit bis zu drei heteroatomen ausgewählt aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel, wobei die genannte heterocyclische oder heteroaromatische Gruppe partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder durch R⁵ substituiert sein kann; worin R⁵ verschiedene Bedeutungen haben kann, sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze, Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I), Mittel, welche diese enthalten, sowie die Verwendung der Verbindungen der Formel (I) und diese enthaltende Mittel zur Schadpflanzenbekämpfung.

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AL	Albanien	ES	Spanien	LS	Lesotho	SI	Slowenien
AM	Armenien	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Slowakei
AT	Österreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Gabun	LV	Lettland	SZ	Swasiland
AZ	Aserbaidschan	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Monaco	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TG	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tadschikistan
BE	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien	TM	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland	ML	Mali	TR	Türkei
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	MN	Mongolei	TT	Trinidad und Tobago
BJ	Benin	IE	Irländ	MR	Mauretanien	UA	Ukraine
BR	Brasilien	IL	Israel	MW	Malawi	UG	Uganda
BY	Belarus	IS	Island	MX	Mexiko	US	Vereinigte Staaten von Amerika
CA	Kanada	IT	Italien	NE	Niger	UZ	Usbekistan
CF	Zentralafrikanische Republik	JP	Japan	NL	Niederlande	VN	Vietnam
CG	Kongo	KE	Kenia	NO	Norwegen	YU	Jugoslawien
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NZ	Neuseeland	ZW	Zimbabwe
CI	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	PL	Polen		
CM	Kamerun	KR	Republik Korea	PT	Portugal		
CN	China	KZ	Kasachstan	RO	Rumänien		
CU	Kuba	LC	St. Lucia	RU	Russische Föderation		
CZ	Tschechische Republik	LI	Liechtenstein	SD	Sudan		
DE	Deutschland	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
DK	Dänemark	LR	Libana	SG	Singapur		
EE	Estland						

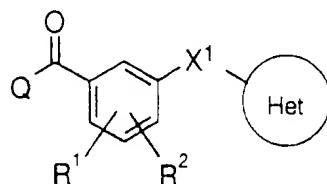
2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dione

5 Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft substituierte 2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dione der Formel I

10

15



I

in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

20

R¹, R² Wasserstoff, Mercapto, Nitro, Halogen, Cyano, Rhodano,
C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy,
C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, -OR³, -OCOR³, -OSO₂R³,
-S(O)_nR³, -SO₂OR³, -SO₂N(R³)₂, -NR³SO₂R³ oder -NR³COR³;

25

R³ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl,
C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, Phenyl oder Phenyl-C₁-C₆-alkyl; wobei die genannten Alkylreste partiell
30 oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:

Hydroxy, Mercapto, Amino, Cyano, R³, -OR³, -SR³, -N(R³)₂,
=NOR³, -OCOR³, -SCOR³, -NR³COR³, -CO₂R³, -COSR³, -CON(R³)₂,
35 C₁-C₄-Alkyliminoxy, C₁-C₄-Alkoxyamino, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₆-alkoxycarbonyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Heterocyclyl, Heterocyclyoxy, Phenyl, Benzyl, Hetaryl, Phenoxy, Benzyloxy und Hetaryloxy, wobei die acht letztgenannten Reste ihrerseits substituiert sein können;

40

n 0, 1 oder 2;

45 Q ein gegebenenfalls substituierter, in 2-Stellung verknüpfter Cyclohexan-1,3-dion-Ring;

- X¹ eine geradkettige oder verzweigte C₁-C₆-Alkylen-, eine C₂-C₆-Alkenylen- oder eine C₂-C₆-Alkinylenkette, wobei die genannten Alkylen-, Alkenylen- oder Alkinylenreste partiell halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:
- 5 -OR⁴, -OCOR⁴, -OCONHR⁴ oder -OSO₂R⁴;
- 10 und wobei die genannten Alkenylenreste ausgenommen sind, bei denen sich die Doppelbindung in α,β-Position zum Phenylring befindet und bei denen Het über die β-Position an die Doppelbindung gebunden ist;
- 15 R⁴ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, wobei die genannten Alkyl-, Alkenyl oder Alkinylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/ oder durch einen oder mehrere der folgenden Reste substituiert sein können:
- 20 Het Hydroxy, Mercapto, Amino, Cyano, Nitro, Formyl, C₁-C₄-Alkylamino, C₁-C₄-Dialkylamino, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₄-Alkylicarbonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy;
- 25 Het 30 eine drei- bis sechsgliedrige, teilweise oder vollständig gesättigte, heterocyclische Gruppe oder eine drei- bis sechsgliedrige heteroaromatische Gruppe mit bis zu drei Heteroatomen ausgewählt aus der Gruppe:
- 35 Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel,
- wobei die genannte heterocyclische oder heteroaromatische Gruppe partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder durch R⁵ substituiert sein kann;
- 40 R⁵ Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Amino, Cyano, Nitro, Formyl, C₁-C₄-Alkylamino, C₁-C₄-Dialkylamino, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₄-Alkylicarbonyl, C₁-C₄-Alkyl-carbonyloxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkyl-thio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogen-alkoxy, wobei die Alkylreste in allen Fällen jeweils durch einen oder mehrere der folgenden Reste substituiert sein können:
- 45

Cyano, Formyl, C₁-C₄-Alkylamino, C₁-C₄-Dialkylamino,
C₁-C₄-Alkoxy carbonyl, C₁-C₄-Alkyl carbonyl, C₁-C₄-Alkyl-
carbonyloxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogen alkyl, C₁-C₄-Alkyl-
thio, C₁-C₄-Halogen alkyl thio, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogen-
alkoxy;

5

sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.

10 Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren und Zwischenprodukte
zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, Mittel welche
diese enthalten, sowie die Verwendung der Verbindungen der For-
mel I und diese enthaltende Mittel zur Schadpflanzenbekämpfung.

15 Aus der Literatur, beispielsweise aus EP-A 278 742, EP-A 298 680,
EP-A 320 864 und WO 96/14285 sind 2-Benzoylcyclohexan-1,3-dione
bekannt.

Die herbiziden Eigenschaften der bisher bekannten Verbindungen
20 sowie die Verträglichkeiten gegenüber Kulturpflanzen können je-
doch nur bedingt befriedigen. Es lag daher dieser Erfindung die
Aufgabe zugrunde, neue, insbesondere herbizid wirksame, Verbin-
dungen mit verbesserten Eigenschaften zu finden.

25 Demgemäß wurden die erfindungsgemäßen 2-Benzoyl-cyclohe-
xan-1,3-dione der Formel I sowie deren herbizide Wirkung gefun-
den.

30 Ferner wurden herbizide Mittel gefunden, die die Verbindungen I
enthalten und eine sehr gute herbizide Wirkung besitzen. Darüber
hinaus wurden Verfahren zur Herstellung dieser Mittel und Verfah-
ren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs mit den
Verbindungen I gefunden.

35 Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind auch Stereoisomere der
Verbindungen der Formel I. Es werden sowohl reine Stereoisomere
als auch Gemische hiervon erfaßt.

40 Die Verbindungen der Formel I können je nach Substitutionsmuster
ein oder mehrere Chiralitätszentren enthalten und liegen dann als
Enantiomeren oder Diastereomerengemische vor. Gegenstand der Er-
findung sind sowohl die reinen Enantiomeren oder Diastereomeren
als auch deren Gemische.

45

Die Verbindungen der Formel I können auch in Form ihrer landwirtschaftlich brauchbaren Salze vorliegen, wobei es auf die Art des Salzes in der Regel nicht ankommt. Im allgemeinen kommen die Salze derjenigen Kationen oder die Säureadditionssalze derjenigen 5 Säuren in Betracht, deren Kationen, beziehungsweise Anionen, die herbizide Wirkung der Verbindungen I nicht negativ beeinträchtigen.

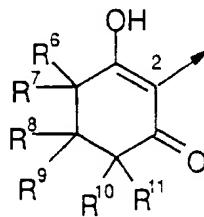
Es kommen als Kationen, insbesondere Ionen der Alkalimetalle, 10 vorzugsweise Lithium, Natrium und Kalium, der Erdalkalimetalle, vorzugsweise Calcium und Magnesium, und der Übergangsmetalle, vorzugsweise Mangan, Kupfer, Zink und Eisen, sowie Ammonium, wobei hier gewünschtenfalls ein bis vier Wasserstoffatome durch C₁-C₄-Alkyl oder Hydroxy-C₁-C₄-alkyl und/oder ein Phenyl oder 15 Benzyl ersetzt sein können, vorzugsweise Diisopropylammonium, Tetramethylammonium, Tetrabutylammonium, Trimethylbenzylammonium, des weiteren Phosphoniumionen, Sulfoniumionen, vorzugsweise Tri(C₁-C₄-alkyl)-sulfonium und Sulfoxoniumionen, vorzugsweise Tri(C₁-C₄-alkyl)-sulfoxonium, in Betracht.

20

Anionen von brauchbaren Säureadditionsalzen sind in erster Linie Chlorid, Bromid, Fluorid, Hydrogensulfat, Sulfat, Dihydrogenphosphat, Hydrogenphosphat, Nitrat, Hydrogencarbonat, Carbonat, 25 Hexafluorosilikat, Hexafluorophosphat, Benzoat sowie die Anionen von C₁-C₄-Alkansäuren, vorzugsweise Formiat, Acetat, Propionat und Butyrat.

Hervorzuheben sind die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel 30 I, wobei die Variable Q einen in 2-Stellung verknüpften Cyclohexan-1,3-dionring der Formel II darstellt,

35

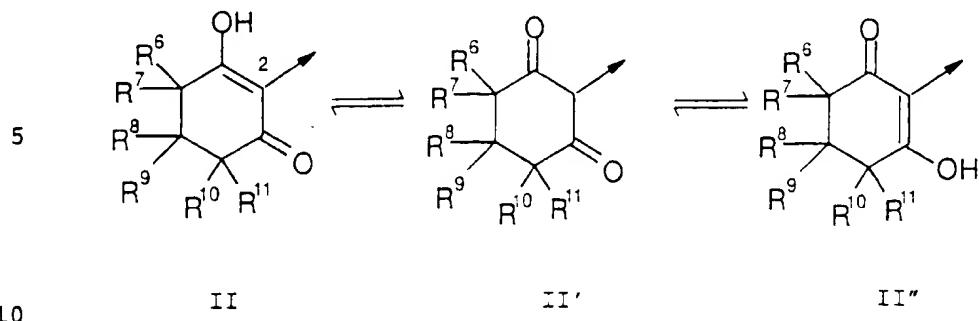


II

40

wobei II auch stellvertretend für die tautomeren Formeln II' und II'' steht,

45



wobei

15 R⁶, R⁷, R⁹ und R¹¹ für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl stehen;

20 R⁸ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₃-C₄-Cycloalkyl steht,
wobei die beiden letztgenannten Gruppen einen bis drei
der folgenden Substituenten tragen können:
Halogen, C₁-C₄-Alkylthio oder C₁-C₄-Alkoxy;

oder

25 für Tetrahydropyran-2-yl, Tetrahydropyran-3-yl, Tetra-
hydropyran-4-yl, Tetrahydrothiopyran-2-yl, Tetrahydro-
thiopyran-3-yl, Tetrahydrothiopyran-4-yl, 1,3-Dioxolan-
2-yl, 1,3-Dioxan-2-yl, 1,3-Oxathiolan-2-yl, 1,3-Oxa-
thian-2-yl, 1,3-Dithiolan-2-yl oder 1,3-Dithian-2-yl
30 steht, wobei die 6 letztgenannten Reste durch ein bis
drei C₁-C₄-Alkylreste substituiert sein können;

35 R¹⁰ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxycarbonyl
steht;

oder

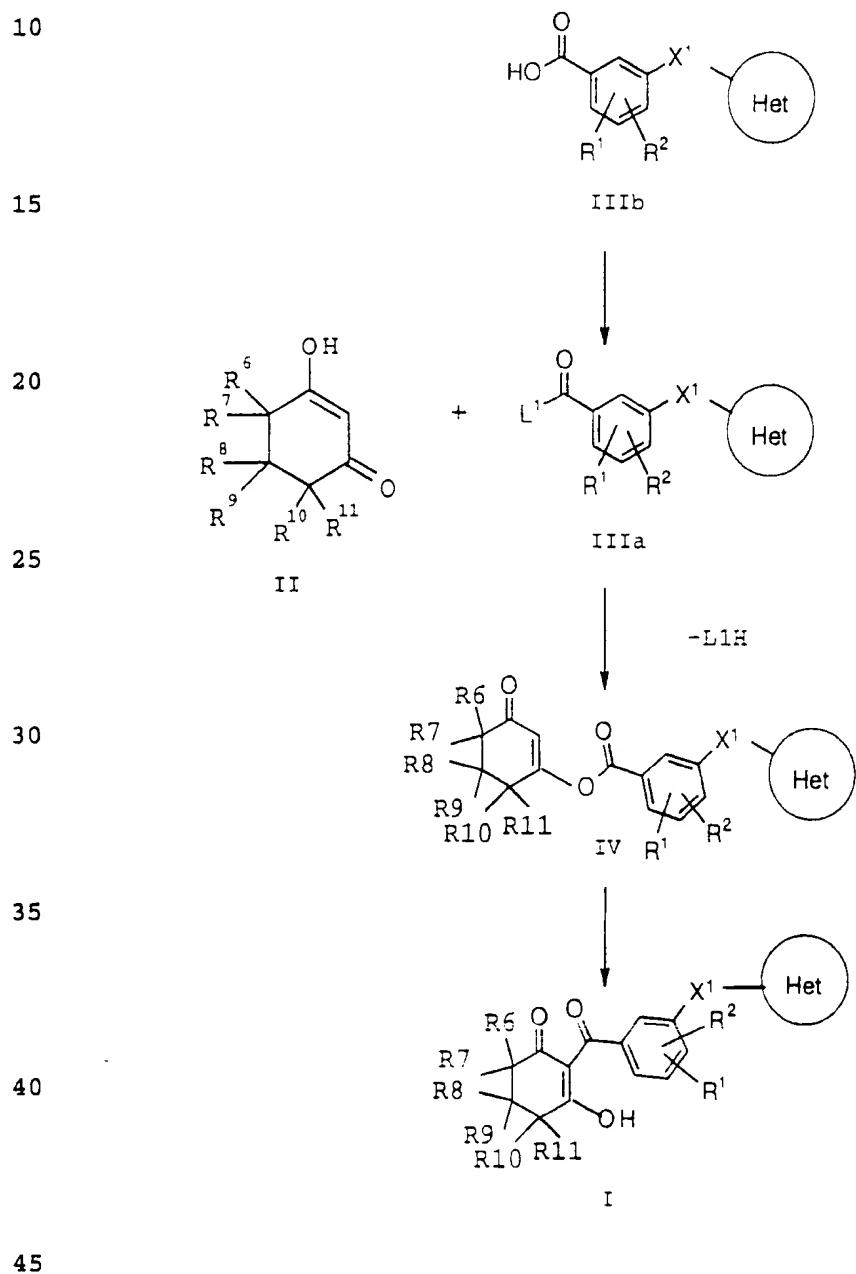
40 R⁸ und R¹¹ gemeinsam eine π-Bindung oder einen drei- bis sechs-
gliedrigen carbocyclischen Ring bilden;

oder

45 die CR⁸R⁹-Einheit durch C=O ersetzt sein kann.

Verfahren A:

Umsetzungen von Cyclohexan-1,3-dion der Formel II mit einer aktivierte
 5 vierten Carbonsäure IIIa oder einer Carbonsäure IIIb die vorzugsweise in situ aktiviert wird, zu dem Acylierungsprodukt IV und anschließende Umlagerung zu den erfundungsgemäßen Verbindungen der Formel I.



Lⁱ steht für eine nucleophil austauschbare Abgangsgruppe, wie Halogen z. B. Brom, Chlor, Hetaryl, z. B. Imidazolyl, Pyridyl, Carboxylat, z. B. Acetat, Trifluoracetat etc.

- 5 Die aktivierte Carbonsäure kann direkt eingesetzt werden, wie im Fall der Carbonsäurehalogenide oder in situ erzeugt werden, z. B. mit Dicyclohexylcarbodiimid, Triphenylphosphin/Azodicarbonsäure-ester, 2-Pyridindisulfit/Triphenylphosphin, Carbonyldiimidazol etc.

10

- Gegebenenfalls kann es von Vorteil sein, die Acylierungsreaktion in Gegenwart einer Base auszuführen. Die Reaktanden und die Hilfsbase werden dabei zweckmäßigerweise in äquimolaren Mengen eingesetzt. Ein geringer Überschuß der Hilfsbase z. B. 1,2 bis 15 1,5 Moläquivalente, bezogen auf II, kann unter Umständen vorteilhaft sein.

Als Hilfsbasen eignen sich tertiäre Alkylamine, Pyridin oder 20 Alkalimetallcarbonate. Als Lösungsmittel können z. B. chlorierte Kohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Toluol, Xylool, Chlorbenzol, Ether, wie Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, polare aprotische Lösungsmittel, wie Acetonitril, 25 Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid oder Ester wie Essigsäure-ethylester oder Gemische hiervon verwendet werden.

Werden Carbonsäurehalogenide als aktivierte Carbonsäurekomponente eingesetzt, so kann es zweckmäßig sein, bei Zugabe dieses Reaktionspartners die Reaktionsmischung auf 0 - 10 °C abzukühlen. Anschließend röhrt man bei 20 - 100 °C, vorzugsweise bei 25 - 50 °C, bis die Umsetzung vollständig ist. Die Aufarbeitung erfolgt in üblicher Weise, z. B. wird das Reaktionsgemisch auf Wasser gegossen, das Wertprodukt extrahiert. Als Lösungsmittel eignen sich 35 hierfür besonders Methylenchlorid, Diethylether und Essigsäure-ethylester. Nach Trocknen der organischen Phase und Entfernen des Lösungsmittels wird der rohe Enolester der Formel IV vorzugsweise durch Chromatographie gereinigt. Es ist aber auch möglich, den rohen Enolester der Formel IV ohne weitere Reinigung zur Umlagerung einzusetzen.

Die Umlagerung der Enolester der Formel IV zu den Verbindungen der Formel I erfolgt zweckmäßigerweise bei Temperaturen von 20 bis 40 °C in einem Lösungsmittel und in Gegenwart einer Base sowie 45 gegebenenfalls in Gegenwart einer Cyanoverbindung.

Als Lösungsmittel können z. B. Acetonitril, Methylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, Dioxan, Essigsäureethylester, Toluol oder Gemische hiervon verwendet werden. Bevorzugte Lösungsmittel sind Acetonitril und Dioxan.

5

Geeignete Basen sind tertiäre Amine wie Triethylamin, Pyridin oder Alkalicarbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, die vorzugsweise in äquimolarer Menge oder bis zu einem vierfachen Überschuß, bezogen auf den Ester, eingesetzt werden. Bevorzugt 10 werden Triethylamin oder Alkalicarbonate verwendet.

Als Cyanoverbindungen kommen anorganische Cyanide, wie Natriumcyanid, Kaliumcyanid und organische Cyanoverbindungen, wie 15 Acetoncyanhydrin, Trimethylsilylcyanid in Betracht. Sie werden in einer Menge von 1 bis 50 Molprozent, bezogen auf den Ester, eingesetzt. Vorzugsweise werden Acetoncyanhydrin oder Trimethylsilylcyanid, z. B. in einer Menge von 5 bis 15, vorzugsweise 10 Molprozent, bezogen auf den Ester, eingesetzt.

20

Besonders bevorzugt werden Alkalicarbonate, wie Kaliumcarbonat, in Acetonitril oder Dioxan eingesetzt.

Die Aufarbeitung kann in an sich bekannter Weise erfolgen. Das 25 Reaktionsgemisch wird z. B. mit verdünnter Mineralsäure, wie 5 %ige Salzsäure oder Schwefelsäure, angesäuert, mit einem organischen Lösungsmittel, z. B. Methylenchlorid, Essigsäureethyl-ester extrahiert. Der organische Extrakt kann mit 5 - 10 %iger 30 Alkalicarbonatlösung, z. B. Natriumcarbonat-, Kaliumcarbonatlösung extrahiert werden. Die wäßrige Phase wird angesäuert und der sich bildende Niederschlag abgesaugt und/oder mit Methylenchlorid oder Essigsäureethylester extrahiert, getrocknet und eingeengt.

(Beispiele für die Darstellung von Estern von Hydroxypyrazolen 35 und für die Umlagerung der Ester sind z. B. in EP-A 282 944 oder US 4 643 757 genannt).

40

Die Benzoesäuren der Formel III sind neu,

45

III

wobei die Variablen folgende Bedeutung haben:

- R¹, R² Wasserstoff, Mercapto, Nitro, Halogen, Cyano, Rhodano,
C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy,
5 C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, -OR³, -OCOR³, -OSO₂R³,
-S(O)_nR³, -SO₂OR³, -SO₂N(R³)₂, -NR³SO₂R³ oder -NR³COR³;
- R³ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl,
10 C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, Phenyl oder Phenyl-C₁-C₆-alkyl; wobei die genannten Alkylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:
- 15 Hydroxy, Mercapto, Amino, Cyano, R³, -OR³, -SR³, -N(R³)₂, =NOR³, -OCOR³, -SCOR³, -NR³COR³, -CO₂R³, -COSR³, -CON(R³)₂, C₁-C₄-Alkyliminoxy, C₁-C₄-Alkoxyamino, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₆-alkoxycarbonyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Heterocyclyl, Heterocycloloxy, Phenyl, Benzyl,
20 Hetaryl, Phenoxy, Benzyloxy und Hetarylloxy, wobei die acht letztgenannten Reste ihrerseits substituiert sein können;
- n 0, 1 oder 2;
- 25 X¹ eine geradkettige oder verzweigte C₁-C₆-Alkylen-, eine C₂-C₆-Alkenylen- oder eine C₂-C₆-Alkinylenkette, wobei die genannten Alkyl-, Alkenyl- oder Alkinylreste partiell halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:
30 -OR⁴, -OCOR⁴, -OCONHR⁴ oder -OSO₂R⁴
- 35 und wobei die genannten Alkylenreste ausgenommen sind, bei denen sich die Doppelbindung in α,β-Position zum Phenylring befindet und bei denen Het über die β-Position an die Doppelbindung gebunden ist;
- 40 R⁴ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, wobei die genannten Alkyl-, Alkenyl oder Alkinylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder durch einen oder mehrere der folgenden Reste substituiert sein können:
- 45 Hydroxy, Mercapto, Amino, Cyano, Nitro, Formyl, C₁-C₄-Alkylamino, C₁-C₄-Dialkylamino, C₁-C₄-Alkoxy-

10

carbonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy,
C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkylthio,
C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy;

5 Het eine drei- bis sechsgliedrige, teilweise oder vollständig gesättigte, heterocyclische Gruppe oder eine drei- bis sechsgliedrige heteroaromatische Gruppe mit bis zu drei Heteroatomen ausgewählt aus der Gruppe:

10 Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel,

wobei die genannte heterocyclische oder heteroaromatische Gruppe partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder durch R⁵ substituiert sein kann;

15 R⁵ Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Amino, Cyano, Nitro, Formyl, C₁-C₄-Alkylamino, C₁-C₄-Dialkylamino, C₁-C₄-Alkoxy carbonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkyl-
20 carbonyloxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkyl-thio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogen-alkoxy, wobei die Alkylreste in allen Fällen jeweils durch einen oder mehrere der folgenden Reste substituiert sein können:

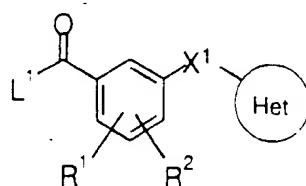
25 Cyano, Formyl, C₁-C₄-Alkylamino, C₁-C₄-Dialkylamino, C₁-C₄-Alkoxy carbonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkyl-carbonyloxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkyl-thio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogen-
30 alkoxy;

R¹² Hydroxy oder ein hydrolysierbarer Rest.

35 Beispiele für hydrolysierbare Reste sind Alkoxy-, Phenoxy-, Alkylthio-, Phenylthioreste, die substituiert sein können, Halogenide, Hetarylreste, die über Stickstoff gebunden sind, Amino-, Iminoreste, die substituiert sein können, etc.

40 Bevorzugt sind Benzoesäurehalogenide IIIa mit L¹ = Halogen (= III mit R¹² = Halogen),

5



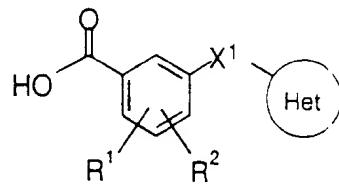
10 wobei die Variablen R¹, R², X¹ und Het die unter Formel III genannte Bedeutung haben und

L¹ Halogen, insbesondere Chlor oder Brom, bedeuten.

15

Ebenso bevorzugt sind Benzoesäuren der Formel IIIb (\cong III mit R¹²= Hydroxy),

20



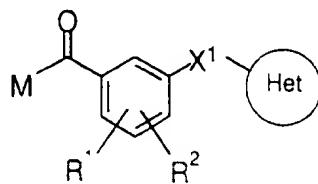
25

wobei die Variablen R¹, R², X¹ und Het die unter Formel III genannte Bedeutung haben.

30

Ebenso bevorzugt sind Benzoesäureester der Formel IIIc (\cong III mit R¹² = C₁-C₆-Alkoxy),

35



40

wobei die Variablen R¹, R², X¹ und Het die unter Formel III genannte Bedeutung haben und

45

M C₁-C₆-Alkoxy

bedeutet.

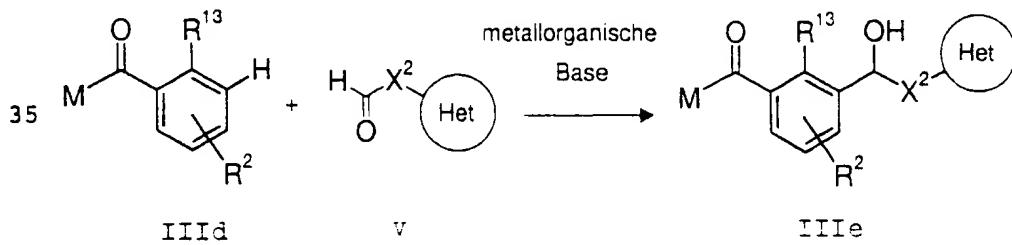
- 5 Die Verbindungen der Formel IIIa (mit L^1 = Halogen) können in Analogie zu literaturbekannten Methoden (vgl. L.G. Fieser, M. Fieser "Reagents for Organic Synthesis", Bd. I, S. 767-769 (1967)) durch Umsetzung von Benzoësäuren der Formel IIIb mit Halogenierungsreaktionen wie Thionylchlorid, Thionylbromid, Phosgen, Diphosgen, Triphosgen, Oxalylichlorid, Oxalylbromid dargestellt werden.

Die Benzoesäuren der Formel IIIb können u. a. durch Verseifung
der Benzoesäureester der Formel IIIC (mit M = C₁-C₆-Alkoxy) erhalten werden.

Die erfindungsgemäßen Benzoësäureester der Formel IIc sind nach verschiedenen literaturbekannten Methoden (z. B. a. G. Dittus in Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Band VI/3, Sauerstoff-Verbindungen I, 4. Aufl., S. 493 ff., Georg Thieme Verlag, 1965; b. T. L. Gilchrist, Heterocyclenchemie, 2. Aufl., Verlag Chemie, 1995) darstellbar, wie in den nachfolgenden Beispielen illustriert.

25 Verfahren B:

Metallierung geeigneter Benzoesäureester IIIc in ortho-Position zur Esterfunktion mit starken, metallorganischen Basen und anschließende 1,2-Addition einer Carbonylverbindung V liefert die
 30 erfindungsgemäßen Benzoesäureester IIIe,



40

wobei R¹³ einen zur ortho-Metallierung geeigneten Substituenten R¹ darstellt (z.B. V. Snieckus, Chem. Rev., 1990, 90, 879), bevorzugt Halogen und C₁-C₆-Alkoxy und

45 X² eine geradkettige oder verzweigte C₁-C₅-Alkylen-, eine C₂-C₅-Alkenylen- oder eine C₂-C₅-Alkinylenkette bedeutet, wobei die genannten Alkylen-, Alkenylen- oder Alkinylen-

13

reste partiell halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:

-OR⁴, -OCOR⁴, -OCONHR⁴ oder -OSO₂R⁴,

5

und wobei die genannten Alkenylenreste ausgenommen sind, bei denen sich die Doppelbindung in α, β -Position zum Phenylring befindet und bei denen Het über die β -Position an die Doppelbindung gebunden ist.

10

Geeignete metallorganische Basen zur ortho-Metallierung der literaturbekannten Benzoesäureester IIId sind z.B. Alkyllithiumverbindungen, bevorzugt n-Butyllithium oder sec-Butyllithium, Lithiumdialkylamide, bevorzugt Lithiumdiisopropylamid oder 15 Natriumhexamethyldisilazid.

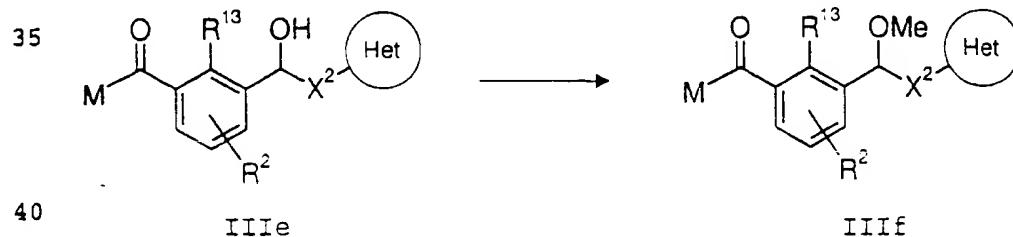
Als geeignete inerte Lösungsmittel kommen bei der direkten ortho-Metallierung z.B. Tetrahydrofuran, Diethylether, 1,2-Dimethoxyethan oder 1,4-Dioxan, Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, 20 Methyl-tert-butylether oder auch Mischungen dieser Lösungsmittel in Betracht.

Die Reaktionstemperaturen können von -80 bis 100°C, vorzugsweise von -80 bis 40°C betragen.

25

Die Umsetzung der in situ erzeugten, ortho-metallierten Benzoesäureester IIId mit den Aldehyden V werden bei Reaktionstemperaturen von -80 bis 100°C durchgeführt.

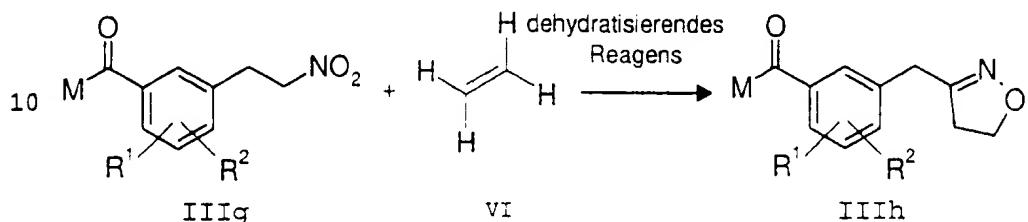
30 Die erfundungsgemäßen Produkte IIIe enthalten eine Hydroxymethylen-Gruppe, die sich für weitere Derivatisierungen nach literaturbekannten Methoden eignet. So kann die Hydroxymethylen-Gruppe z.B. zur Methoxy-Gruppe methyliert werden.



45

Verfahren C:

1,3-dipolare Cycloaddition der Benzoësäureester IIIg mit gegebenenfalls substituierten Olefinen oder Acetylenen unter 5 dehydratisierenden Bedingungen liefert die erfindungsgemäßen Benzoësäureester, wie beispielsweise IIIh.



15

Zur Dehydratisierung nach der Methode von Mukaiyama werden bevorzugt aromatische Isocyanate (z.B. T. Mukaiyama et al., J. Am. Chem. Soc. 1960, 82, 5339), wie z.B. Phenylisocyanat oder 4-Chlorphenylisocyanat eingesetzt.

20

In der Variante nach Shimizu eignen sich ebenfalls aliphatische Chlorameisensäureester (z.B. T. Shimizu et al., Bull. Chem. Soc. Jpn. 1986, 59, 2827), bevorzugt Ethylchloroformat.

25

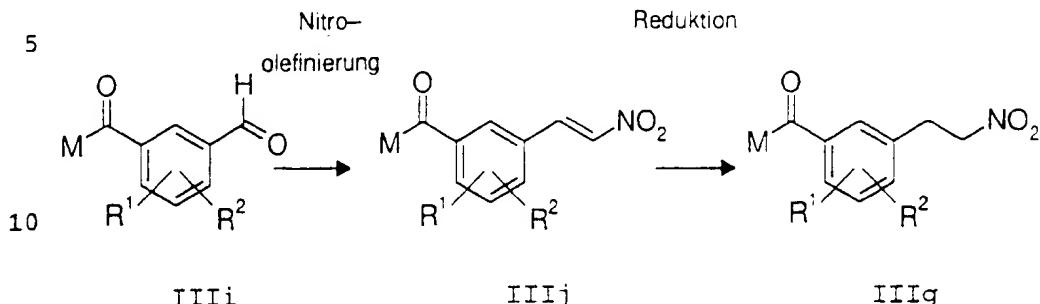
Neuere Entwicklungen zeigen, daß z.B. auch N,N-Diethylamino-schweifeltrifluorid (DAST), (Methoxycarbonylsulfamoyl)-triethylammoniumhydroxid (Burgess Reagens), Phosphorylchlorid (z.B. C. Mioskowski et al., Tetrahedron Letters 1997, 38, 1547) oder auch eine Kombination aus Di-tert-butyl-dicarbonat (Boc₂O) und 30 4-Dimethylaminopyridin (DMAP) (A. Hassner et al., Synthesis 1997, 309) erfolgreich als dehydratisierende Reagenzien zur Erzeugung von Nitriloxiden eingesetzt werden können.

Die auf diese Weise in situ gebildeten Nitriloxide können bei 35 Raumtemperatur bis zur Siedetemperatur des verwendeten Lösungsmittels mit beliebig substituierten Olefinen oder Acetylen zu den erfindungsgemäßen Benzoësäureestern IIIc umgesetzt werden, wobei hier beispielsweise X¹ eine Methylengruppe und Het einen gegebenenfalls substituierten Isoxazol- oder Isoxazolingerüst darstellt.

Die Durchführung der Cycloaddition erfolgt in inerten Lösungsmitteln, wie beispielsweise Toluol, Chloroform oder Acetonitril.

Der Benzoësäureester IIIg kann durch Reduktion nach literaturbekannten Methoden aus IIIj erhalten werden, der durch Nitroolefinierung (z.B. a. V. V. Perekalin et al., Nitroalkenes, John

Wiley & Sons Ltd., New York 1994, b. A. G. M. Barrett et al., Chem. Rev. 1986, 86, 751) des entsprechenden Aldehyds IIIi hergestellt werden kann.



15 Hervorzuheben sind die erfundungsgemäßen Verbindungen der Formel I, wobei die Gruppe X¹ entweder für eine C₁-C₂-Alkylen- oder eine C₂-Alkenylenkette steht und

20 Het eine drei- bis sechsgliedrige, teilweise oder vollständig gesättigte, heterocyclische Gruppe oder eine drei- bis sechsgliedrige heteroaromatische Gruppe mit bis zu drei Heteroatomen ausgewählt aus der Gruppe:

25 Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel,

wobei die genannte heterocyclische oder heteroaromatische Gruppe partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder durch R⁵ substituiert sein kann,

30

Darüber hinaus sind die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I hervorzuheben, wobei die Gruppe Het für eine fünf- oder sechsgliedrige, teilweise oder vollständig gesättigte heterocyclische oder eine fünf- oder sechsgliedrige heteroaromatische Gruppe mit bis zu drei Heteroatomen ausgewählt aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel steht, wobei die genannte heterocyclische oder heteroaromatische Gruppe partiell oder vollständig halogeniert und/oder durch R⁵ substituiert sein kann;

R⁵ Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Amino, Cyano, Nitro,
 Formyl, C₁-C₄-Alkylamino, C₁-C₄-Dialkylamino,
 45 C₁-C₄-Alkoxy carbonyl, C₁-C₄-Alkyl carbonyl, C₁-C₄-Alkyl-
 carbonyloxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogen alkyl, C₁-C₄-Alkyl-
 thio, C₁-C₄-Halogen alkyl thio, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogen-

alkoxy, wobei die Alkylreste in allen Fällen jeweils durch einen oder mehrere der folgenden Reste substituiert sein können:

5 Cyano, Formyl, C₁-C₄-Alkylamino, C₁-C₄-Dialkylamino,
C₁-C₄-Alkoxy carbonyl, C₁-C₄-Alkyl carbonyl, C₁-C₄-Alkyl-
carbonyloxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogen alkyl, C₁-C₄-Alkyl-
thio, C₁-C₄-Halogen alkyl thio, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogen-
alkoxy.

10 Die für die Substituenten R¹ - R¹³ oder als Reste an Phenyl-,
Hetaryl- und Heterocyclicringen genannten organischen Molekül-
teile stellen Sammelbegriffe für individuelle Aufzählungen der
einzelnen Gruppenmitglieder dar. Sämtliche Kohlenwasserstoffket-
ten, also alle Alkyl-, Halogen alkyl-, Cycloalkyl-, Alkoxy alkyl-,
Alkoxy-, Halogen alkoxy-, Alkylimino oxy-, Alkoxy amino-, Alkyl-
sulfonyl-, Halogen alkyl sulfonyl, Alkyl carbonyl-, Halogen alkyl-
carbonyl, Alkoxy carbonyl-, Alkoxy alkoxycarbonyl-, Alkenyl-,
Cycloalkenyl-, Alkinyl-Teile können geradkettig oder verzweigt
15 sein. Sofern nicht anders angegeben tragen halogenierte
Substituenten vorzugsweise ein bis fünf gleiche oder verschiedene
Halogenatome. Die Bedeutung Halogen steht jeweils für Fluor,
Chlor, Brom oder Iod.

20 25 Ferner bedeuten beispielsweise:

- C₁-C₄-Alkyl, sowie die Alkylteile von C₁-C₄-Alkyl carbonyl:
Methyl, Ethyl, n-Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methyl-
30 propyl, 2-Methylpropyl und 1,1-Dimethylethyl;
- C₁-C₆-Alkyl, sowie die Alkylteile von C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl
und C₁-C₆-Alkyl carbonyl: C₁-C₄-Alkyl, wie voranstehend ge-
nannt, sowie Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methyl-
butyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl,
35 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl,
2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethyl-
butyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethyl-
butyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl,
40 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl
und 1-Ethyl-3-methylpropyl;
- C₁-C₄-Halogen alkyl: einen C₁-C₄-Alkylrest wie vorstehend ge-
nannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom
und/oder Iod substituiert ist, also z. B. Chlormethyl,
45 Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl,
Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlor-
difluormethyl, 2-Fluorethyl, 2-Chlorethyl, 2-Bromethyl,
2-Iodethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl,

- 2-Chlor-2-fluoreethyl, 2-Chlor-2,2-difluoreethyl,
2,2-Dichlor-2-fluoreethyl, 2,2,2-Trichloreethyl, Pentafluor-
ethyl, 2-Fluorpropyl, 3-Fluorpropyl, 2,2-Difluorpropyl,
2,3-Difluorpropyl, 2-Chlorpropyl, 3-Chlorpropyl, 2,3-Dichlor-
propyl, 2-Brompropyl, 3-Brompropyl, 3,3,3-Trifluorpropyl,
3,3,3-Trichlorpropyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropyl, Heptafluor-
propyl, 1-(Fluormethyl)-2-fluoreethyl, 1-(Chlor-
methyl)-2-chloreethyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethyl, 4-Fluor-
butyl, 4-Chlorbutyl, 4-Brombutyl und Nonafluorbutyl;
- 10 - C₁-C₆-Halogenalkyl, sowie die Halogenalkylteile von
C₁-C₆-Halogenalkylcarbonyl: C₁-C₄-Halogenalkyl wie voran-
stehend genannt, sowie 5-Fluorpentyl, 5-Chlorpentyl, 5-Bromo-
pentyl, 5-Iodpentyl, Undecafluorpentyl, 6-Fluorhexyl,
6-Chlorhexyl, 6-Bromhexyl, 6-Iodhexyl und Dodecafluorhexyl;
- 15 - C₁-C₄-Alkoxy, sowie die Alkoxyteile von C₁-C₄-Alkoxyamino,
C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₆-alkoxycarbonyl und C₁-C₄-Alkoxycarbonyl:
Methoxy, Ethoxy, Propoxy, 1-Methylethoxy, Butoxy, 1-Methyl-
propoxy, 2-Methylpropoxy und 1,1-Dimethylethoxy;
- 20 - C₁-C₆-Alkoxy, sowie die Alkoxyteile von C₁-C₆-Alko-
xy-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₄-Alko-
xy-C₂-C₆-alkoxycarbonyl und C₁-C₆-Alkoxycarbonyl: C₁-C₄-Alkoxy
wie voranstehend genannt, sowie Pentoxy, 1-Methylbutoxy,
2-Methylbutoxy, 3-Methoxylbutoxy, 1,1-Dimethylpropoxy,
- 25 - 1,2-Dimethylpropoxy, 2,2-Dimethylpropoxy, 1-Ethylpropoxy,
Hexoxy, 1-Methylpentoxy, 2-Methylpentoxy, 3-Methylpentoxy,
4-Methylpentoxy, 1,1-Dimethylbutoxy, 1,2-Dimethylbutoxy,
1,3-Dimethylbutoxy, 2,2-Dimethylbutoxy, 2,3-Dimethylbutoxy,
3,3-Dimethylbutoxy, 1-Ethylbutoxy, 2-Ethylbutoxy, 1,1,2-Tri-
- 30 - methylpropoxy, 1,2,2-Trimethylpropoxy, 1-Ethyl-1-methyl-
propoxy und 1-Ethyl-2-methylpropoxy;
- C₁-C₄-Halogenalkoxy: einen C₁-C₄-Alkoxyrest wie voranstehend
genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor,
Brom und/oder Iod substituiert ist, also z. B. Fluormethoxy,
Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Bromdi-
fluormethoxy, 2-Fluorethoxy, 2-Chlorethoxy, 2-Bromethoxy,
2-Iodethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy,
2-Chlor-2-fluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy,
2,2-Dichlor-2-fluorethoxy, 2,2,2-Trichlorethoxy, Pentafluor-
ethoxy, 2-Fluorpropoxy, 3-Fluorpropoxy, 2-Chlorpropoxy,
3-Chlorpropoxy, 2-Brompropoxy, 3-Brompropoxy, 2,2-Difluor-
propoxy, 2,3-Difluorpropoxy, 2,3-Dichlorpropoxy, 3,3,3-Tri-
fluorpropoxy, 3,3,3-Trichlorpropoxy, 2,2,3,3,3-Pentafluor-
propoxy, Heptafluorpropoxy, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethoxy,
1-(Chlormethyl)-2-chlorethoxy, 1-(Brommethyl)-2-bromethoxy,
4-Fluorbutoxy, 4-Chlorbutoxy, 4-Brombutoxy und Nonafluor-
butoxy;

- C₁-C₄-Alkylsulfonyl (C₁-C₄-Alkyl-S(=O)₂-): Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Propylsulfonyl, 1-Methylethylsulfonyl, Butylsulfonyl, 1-Methylpropylsulfonyl, 2-Methylpropylsulfonyl und 1,1-Dimethylethylsulfonyl;
- 5 - C₁-C₆-Alkylsulfonyl: C₁-C₄-Alkylsulfonyl wie voranstehend genannt, sowie Pentylsulfonyl, 1-Methylbutylsulfonyl, 2-Methylbutylsulfonyl, 3-Methylbutylsulfonyl, 2,2-Dimethylpropylsulfonyl, 1-Ethylpropylsulfonyl, 1,1-Dimethylpropylsulfonyl, 1,2-Dimethylpropylsulfonyl, Hexylsulfonyl, 1-Methylpentylsulfonyl, 2-Methylpentylsulfonyl, 3-Methylpentylsulfonyl, 4-Methylpentylsulfonyl, 1,1-Dimethylbutylsulfonyl, 1,2-Dimethylbutylsulfonyl, 1,3-Dimethylbutylsulfonyl, 2,2-Dimethylbutylsulfonyl, 2,3-Dimethylbutylsulfonyl, 3,3-Dimethylbutylsulfonyl, 1-Ethylbutylsulfonyl, 2-Ethylbutylsulfonyl, 1,1,2-Trimethylpropylsulfonyl, 1,2,2-Tri-methylpropylsulfonyl, 1-Ethyl-1-methylpropylsulfonyl und 1-Ethyl-2-methylpropylsulfonyl;
- 10 - C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl: einen C₁-C₆-Alkylsulfonylrest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/ oder Iod substituiert ist, also Fluormethylsulfonyl, Difluormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfonyl, Chlordifluormethylsulfonyl, Bromdifluormethylsulfonyl, 2-Fluorethylsulfonyl, 2-Chlorethylsulfonyl, 2-Bromethylsulfonyl, 2-Iodethylsulfonyl, 2,2-Difluorethylsulfonyl, 2,2,2-Trifluorethylsulfonyl, 2,2,2-Trichlorethylsulfonyl, 2-Chlor-2-fluorethylsulfonyl, 2-Chlor-2,2-difluorethylsulfonyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethylsulfonyl, Pentafluorethylsulfonyl, 2-Fluorpropylsulfonyl, 3-Fluorpropylsulfonyl, 2-Chlorpropylsulfonyl, 3-Chlorpropylsulfonyl, 2-Brompropylsulfonyl, 3-Brompropylsulfonyl, 2,2-Difluorpropylsulfonyl, 2,3-Difluorpropylsulfonyl, 2,3-Dichlorpropylsulfonyl, 3,3,3-Trifluorpropylsulfonyl, 3,3,3-Trichlorpropylsulfonyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylsulfonyl, Heptafluorpropylsulfonyl, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylsulfonyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylsulfonyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethylsulfonyl, 4-Fluorbutylsulfonyl, 4-Chlorbutylsulfonyl, 4-Brombutylsulfonyl, Nonafluorbutylsulfonyl, 5-Fluorpentylsulfonyl, 5-Chlorpentylsulfonyl, 5-Brompentylsulfonyl, 5-Iodpentylsulfonyl, 6-Fluorhexylsulfonyl, 6-Bromhexylsulfonyl, 6-Iodhexylsulfonyl und Dodecafluorhexylsulfonyl;
- 15 - C₁-C₄-Alkyliminoxy: Methyliminoxy, Ethyliminoxy, 1-Propyliminoxy, 2-Propyliminoxy, 1-Butyliminoxy und 2-Butyliminoxy;
- 20 - C₃-C₆-Alkenyl: Prop-1-en-1-yl, Prop-2-en-1-yl, 1-Methyl-ethenyl, Buten-1-yl, Buten-2-yl, Buten-3-yl, 1-Methyl-prop-1-en-1-yl, 2-Methyl-prop-1-en-1-yl, 1-Methyl-prop-2-en-

1-y1, 2-Methyl-prop-2-en-1-y1, Penten-1-y1, Penten-2-y1,
Penten-3-y1, Penten-4-y1, 1-Methyl-but-1-en-1-y1, 2-Methyl-
but-1-en-1-y1, 3-Methyl-but-1-en-1-y1, 1-Methyl-
but-2-en-1-y1, 2-Methyl-but-2-en-1-y1, 3-Methyl-
but-2-en-1-y1, 1-Methyl-but-3-en-1-y1, 2-Methyl-
but-3-en-1-y1, 3-Methyl-but-3-en-1-y1, 1,1-Dimethyl-
prop-2-en-1-y1, 1,2-Dimethyl-prop-1-en-1-y1, 1,2-Dimethyl-
prop-2-en-1-y1, 1-Ethyl-prop-1-en-2-y1, 1-Ethyl-
prop-2-en-1-y1, Hex-1-en-1-y1, Hex-2-en-1-y1, Hex-3-en-1-y1,
Hex-4-en-1-y1, Hex-5-en-1-y1, 1-Methyl-pent-1-en-1-y1, 2-Me-
thyl-pent-1-en-1-y1, 3-Methyl-pent-1-en-1-y1, 4-Methyl-
pent-1-en-1-y1, 1-Methyl-pent-2-en-1-y1, 2-Methyl-
pent-2-en-1-y1, 3-Methyl-pent-2-en-1-y1, 4-Methyl-
pent-2-en-1-y1, 1-Methyl-pent-3-en-1-y1, 2-Methyl-
pent-3-en-1-y1, 3-Methyl-pent-3-en-1-y1, 4-Methyl-
pent-3-en-1-y1, 1-Methyl-pent-4-en-1-y1, 2-Methyl-
pent-4-en-1-y1, 3-Methyl-pent-4-en-1-y1, 4-Methyl-
pent-4-en-1-y1, 1,1-Dimethyl-but-2-en-1-y1, 1,1-Dimethyl-
but-3-en-1-y1, 1,2-Dimethyl-but-1-en-1-y1, 1,2-Dimethyl-
but-2-en-1-y1, 1,2-Dimethyl-but-3-en-1-y1, 1,3-Dimethyl-
but-1-en-1-y1, 1,3-Dimethyl-but-2-en-1-y1, 1,3-Dimethyl-
but-3-en-1-y1, 2,2-Dimethyl-but-3-en-1-y1, 2,3-Dimethyl-
but-1-en-1-y1, 2,3-Dimethyl-but-2-en-1-y1, 2,3-Dimethyl-
but-3-en-1-y1, 3,3-Dimethyl-but-1-en-1-y1, 3,3-Dimethyl-
but-2-en-1-y1, 1-Ethyl-but-1-en-1-y1, 1-Ethyl-but-2-en-1-y1,
1-Ethyl-but-3-en-1-y1, 2-Ethyl-but-1-en-1-y1, 2-Ethyl-
but-2-en-1-y1, 2-Ethyl-but-3-en-1-y1, 1,1,2-Trimethyl-
prop-2-en-1-y1, 1-Ethyl-1-methyl-prop-2-en-1-y1,
1-Ethyl-2-methyl-prop-1-en-1-y1 und 1-Ethyl-2-methyl-
prop-2-en-1-y1;
- C₂-C₆-Alkenyl: C₃-C₆-Alkenyl wie voranstehend genannt, sowie
Ethenyl;
- C₃-C₆-Alkinyl: Prop-1-in-1-y1, Prop-2-in-1-y1, But-1-in-1-y1,
But-1-in-3-y1, But-1-in-4-y1, But-2-in-1-y1, Pent-1-in-1-y1,
35 Pent-1-in-3-y1, Pent-1-in-4-y1, Pent-1-in-5-y1,
Pent-2-in-1-y1, Pent-2-in-4-y1, Pent-2-in-5-y1,
3-Methyl-but-1-in-3-y1, 3-Methyl-but-1-in-4-y1,
Hex-1-in-1-y1, Hex-1-in-3-y1, Hex-1-in-4-y1, Hex-1-in-5-y1,
Hex-1-in-6-y1, Hex-2-in-1-y1, Hex-2-in-4-y1, Hex-2-in-5-y1,
40 Hex-2-in-6-y1, Hex-3-in-1-y1, Hex-3-in-2-y1, 3-Methyl-
pent-1-in-1-y1, 3-Methyl-pent-1-in-3-y1, 3-Methyl-
pent-1-in-4-y1, 3-Methyl-pent-1-in-5-y1, 4-Methyl-
pent-1-in-1-y1, 4-Methyl-pent-2-in-4-y1 und 4-Methyl-
pent-2-in-5-y1;
45

20

- C₂-C₆-Alkinyl: C₃-C₆-Alkinyl, wie voranstehend genannt, sowie Ethinyl:
- C₃-C₆-Cycloalkyl: Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und
5 Cyclohexyl;
- C₄-C₆-Cycloalkenyl: Cyclobuten-1-yl, Cyclobuten-3-yl, Cyclo-
penten-1-yl, Cyclopenten-3-yl, Cyclopenten-4-yl, Cyclo-
hexen-1-yl, Cyclohexen-3-yl und Cyclohexen-4-yl;
- 10 - Heterocyclyl, sowie die Heterocyclreste in Heterocyclyloxy:
drei- bis siebengliedrige, gesättigte oder partiell unge-
sättigte mono- oder polycyclische Heterocyclen, die ein bis
drei Heteroatome ausgewählt aus einer Gruppe bestehend aus
Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel enthalten, wie Oxiranyl,
15 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydro-
thienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl,
3-Isoxazolidinyl, 4-Isoxazolidinyl, 5-Isoxazolidinyl, 3-Iso-
thiazolidinyl, 4-Iothiazolidinyl, 5-Iothiazolidinyl,
3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxa-
20 zolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl,
4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl,
4-Imidazolidinyl, 1,2,4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Oxadia-
zolidin-5-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thadia-
zolidin-5-yl, 1,2,4-Triazolidin-3-yl, 1,3,4-Oxadia-
25 zolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Tri-
azolidin-2-yl, 2,3-Dihydrofuran-2-yl, 2,3-Dihydrofuran-3-yl,
2,3-Dihydrofuran-4-yl, 2,3-Dihydrofuran-5-yl, 2,5-Dihydro-
furan-2-yl, 2,5-Dihydrofuran-3-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl,
2,3-Dihydrothien-3-yl, 2,3-Dihydrothien-4-yl, 2,3-Dihydro-
thien-5-yl, 2,5-Dihydrothien-2-yl, 2,5-Dihydrothien-3-yl,
30 2,3-Dihydropyrrol-2-yl, 2,3-Dihydropyrrol-3-yl, 2,3-Dihydro-
pyrrol-4-yl, 2,3-Dihydropyrrol-5-yl, 2,5-Dihydropyrrol-2-yl,
2,5-Dihydropyrrol-3-yl, 2,3-Dihydroisoxazol-3-yl, 2,3-Dihy-
droisoxazol-4-yl, 2,3-Dihydroisoxazol-5-yl, 4,5-Dihydroisoxa-
35 zol-3-yl, 4,5-Dihydroisoxazol-4-yl, 4,5-Dihydroisoxazol-5-yl,
2,5-Dihydroisoxazol-3-yl, 2,5-Dihydroisoxazol-4-yl, 2,5-Dihy-
droisoxazol-5-yl, 2,3-Dihydroisothiazol-3-yl, 2,3-Dihydroiso-
thiazol-4-yl, 2,3-Dihydroisothiazol-5-yl, 4,5-Dihydroisothia-
zol-3-yl, 4,5-Dihydroisothiazol-4-yl, 4,5-Dihydroisothia-
40 zol-5-yl, 2,5-Dihydroisothiazol-3-yl, 2,5-Dihydroisothia-
zol-4-yl, 2,5-Dihydroisothiazol-5-yl, 2,3-Dihydro-
pyrazol-3-yl, 2,3-Dihydropyrazol-4-yl, 2,3-Dihydro-
pyrazol-5-yl, 4,5-Dihydropyrazol-3-yl, 4,5-Dihydro-
pyrazol-4-yl, 4,5-Dihydropyrazol-5-yl, 2,5-Dihydro-
45 pyrazol-3-yl, 2,5-Dihydropyrazol-4-yl, 2,5-Dihydro-
pyrazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 2,3-Dihydrooxazol-4-yl,
2,3-Dihydrooxazol-5-yl, 4,5-Dihydrooxazol-2-yl, 4,5-Dihydro-

oxazol-4-yl, 4,5-Dihydrooxazol-5-yl, 2,5-Dihydrooxazol-2-yl,
 2,5-Dihydrooxazol-4-yl, 2,5-Dihydrooxazol-5-yl, 2,3-Dihydro-
 thiazol-2-yl, 2,3-Dihydrothiazol-4-yl, 2,3-Dihydrothia-
 zol-5-yl, 4,5-Dihydrothiazol-2-yl, 4,5-Dihydrothiazol-4-yl,
 5 4,5-Dihydrothiazol-5-yl, 2,5-Dihydrothiazol-2-yl, 2,5-Dihy-
 drothiazol-4-yl, 2,5-Dihydrothiazol-5-yl, 2,3-Dihydroimidza-
 zol-2-yl, 2,3-Dihydroimidazol-4-yl, 2,3-Dihydroimidazol-5-yl,
 10 4,5-Dihydroimidazol-2-yl, 4,5-Dihydroimidazol-4-yl, 4,5-Dihy-
 droimidazol-5-yl, 2,5-Dihydroimidazol-2-yl, 2,5-Dihydroimidza-
 zol-4-yl, 2,5-Dihydroimidazol-5-yl, 2-Morpholinyl,
 3-Morpholinyl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl,
 3-Tetrahydropyridazinyl, 4-Tetrahydropyridazinyl, 2-Tetra-
 hydropyrimidinyl, 4-Tetrahydropyrimidinyl, 5-Tetrahydro-
 pyrimidinyl, 2-Tetrahydropyrazinyl, 1,3,5-Tetrahydrotria-
 15 zin-2-yl, 1,2,4-Tetrahydrotriazin-3-yl, 1,3-Dihydro-
 oxazin-2-yl, 1,3-Dithian-2-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 3-Tetra-
 hydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydrothiopyranyl,
 3-Tetrahydrothiopyranyl, 4-Tetrahydrothiopyranyl,
 1,3-Dioxolan-2-yl, 3,4,5,6-Tetrahydropyridin-2-yl,
 20 4H-1,3-Thiazin-2-yl, 4H-3,1-Benzothiazin-2-yl,
 1,1-Dioxo-2,3,4,5-tetrahydrothien-2-yl, 2H-1,4-Benzothia-
 zin-3-yl, 2H-1,4-Benzoxazin-3-yl, 1,3-Dihydrooxazin-2-yl,
 - Hetaryl, sowie die Hetarylreste in Hetaryloxy:
 25 aromatische mono- oder polycyclische Reste, welche neben
 Kohlenstoffringgliedern zusätzlich ein bis vier Stickstoff-
 atome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Sauerstoff-
 oder ein Schwefelatom oder ein Sauerstoff- und ein Schwefel-
 atom enthalten können, z. B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl,
 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl,
 30 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Iothiazolyl, 4-Iothiazolyl,
 5-Iothiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxa-
 zolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl,
 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl,
 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl,
 35 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Tri-
 azol-3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl,
 1,3,4-Triazol-2-yl, 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl,
 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl,
 40 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl, 1,2,4-Tri-
 azin-3-yl, 1,2,4,5-Tetrazin-3-yl, sowie die entsprechenden
 benzokondensierten Derivate.

Alle Phenyl-, Hetaryl- und Heterocyclen sind vorzugsweise
 unsubstituiert oder tragen ein bis drei Halogenatome und/oder
 45 einen oder zwei Reste aus folgender Gruppe: Nitro, Cyano, Methyl,
 Trifluormethyl, Methoxy, Trifluormethoxy oder Methoxycarbonyl.

In Hinblick auf die Verwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I als Herbizide haben die Variablen vorzugsweise folgende Bedeutungen, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination:

5

R¹ Nitro, Halogen, Cyano, Rhodano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, -OR³ oder -S(O)_nR³;

10 besonders bevorzugt Nitro, Halogen wie z.B. Fluor, Chlor oder Brom, C₁-C₆-Halogenalkyl, -OR³ oder -SO₂R³;

15 R² Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, Rhodano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-Alkenyl,

besonders bevorzugt Wasserstoff, Nitro, Halogen wie z.B. Fluor, Chlor oder Brom, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, -OR³ oder -SO₂R³;

20 R³ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, Phenyl oder Phenyl-C₁-C₆-alkyl;

25 besonders bevorzugt Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₂-C₃-Alkenyl, C₂-C₃-Alkinyl oder Phenyl; wobei die genannten Alkylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:

30 Hydroxy, Mercapto, Amino, Cyano, R³, -OR³, -SR³, -N(R³)₂, =NOR³, -OCOR³, -SCOR³, -NR³COR³, -CO₂R³, -COSR³, -CON(R³)₂, C₁-C₄-Alkyliminoxy, C₁-C₄-Alkoxyamino, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₆-alkoxycarbonyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Heterocyclyl, Heterocyclxyloxy, Phenyl, Benzyl, Hetaryl, Phenoxyl, Benzyloxy und Hetaryloxy, wobei die acht letztgenannten Reste ihrerseits substituiert sein können;

35 n 0, 1 oder 2, besonders bevorzugt 0 oder 2;

40 x¹ eine geradkettige oder verzweigte C₁-C₄-Alkylen-, eine Propylen- oder Butenylen- oder eine C₂-C₄-Alkinylketten, besonders bevorzugt eine Methylen-, Ethylen-, Propylen-, Propenylen-, Ethinylen oder Propinylenkette, wobei die genannten Alkylen-, Alkenyen- oder Alkinylketten partiell halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:

-OR⁴, -OCOR⁴, -OCONHR⁴ oder -OSO₂R⁴

und wobei die genannten Alkenylenreste ausgenommen sind, bei
denen sich die Doppelbindung in α,β -Position zum Phenylring
5 befindet und bei denen Het über die β -Position an die Doppel-
bindung gebunden ist;

10 R⁴ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl; besonders
bevorzugt Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder Trifluormethyl;

15 R⁵ C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl; besonders bevorzugt
Methyl, Ethyl, Propyl, Isopropyl, Butyl oder Isobutyl;

20 R⁶, R⁷, R¹¹ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;
besonders bevorzugt Wasserstoff, Methyl oder Ethyl;

25 R⁸ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₄-Cycloalkyl, wobei die beiden
letztgenannten Gruppen gegebenenfalls einen bis drei der
folgenden Substituenten tragen können: Halogen, C₁-C₄-Alkoxy
oder C₁-C₄-Alkylthio;

30 Tetrahydropyran-2-yl, Tetrahydropyran-3-yl, Tetrahydro-
pyran-4-yl, Tetrahydrothiopyran-2-yl, Tetrahydrothio-
pyran-3-yl, Tetrahydrothiopyran-4-yl, 1,3-Dioxolan-2-yl,
1,3-Dioxan-2-yl, 1,3-Oxathiolan-2-yl, 1,3-Oxathian-2-yl,
25 1,3-Dithian-2-yl oder 1,3-Dithiolan-2-yl, wobei die sechs
letztgenannten Gruppen jeweils einen bis drei C₁-C₄-Alkylreste
tragen können;

35 besonders bevorzugt Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Cyclopropyl,
Di(methoxy)methyl, Di(ethoxy)methyl, 2-Ethylthiopropyl,
Tetrahydropyran-2-yl, Tetrahydropyran-3-yl, Tetrahydro-
pyran-4-yl, Tetrahydrothiopyran-2-yl, Tetrahydrothio-
pyran-3-yl, Tetrahydrothiopyran-4-yl, 1,3-Dioxolan-2-yl,
1,3-Dioxan-2-yl, 5,5-Dimethyl-1,3-dioxan-2-yl, 1,3-Oxa-
thiolan-2-yl, 1,3-Oxathian-2-yl, 1,3-Dithiolan-2-yl,
5,5-Dimethyl-1,3-dithian-2-yl oder 1-Methylthiocyclopropyl;

40 R¹⁰ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl;
besonders bevorzugt Wasserstoff, Methyl oder Methoxycarbonyl.

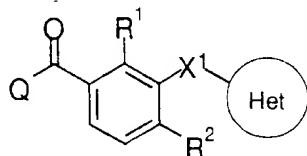
45 Ebenso kann vorteilhaft in Betracht kommen, daß R⁸ und R¹¹ eine
 π -Bindung ausbilden, so daß ein Doppelbindungs system entsteht.

Die CR⁸R⁹-Einheit kann auch vorteilhaft durch C=O ersetzt werden.

24

Insbesondere bevorzugt sind die Verbindungen der Formel Ia, wobei R¹ in Position 2 und R² in Position 4 des Phenylringes gebunden sind.

5



10

Ia

Außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel Ia, in der die Substituenten R¹ und R² und Q die oben genannte Bedeutung haben, X¹ für eine C₁-C₂-Alkylen- oder eine C₂-Alkinylene Kette steht und

20 Het eine drei- bis sechsgliedrige, teilweise oder vollständig gesättigte, heterocyclische Gruppe oder eine drei- bis sechs-gliedrige heteroaromatische Gruppe mit bis zu drei Hetero-atomen ausgewählt aus der Gruppe:

Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel,

25

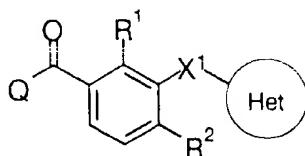
wobei die genannte heterocyclische oder heteroaromatische Gruppe partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/ oder durch R⁵ substituiert sein kann;

30 bedeutet.

Insbesondere bevorzugt sind die Verbindungen der Formel Ia, wobei R¹ in Position 2 und R² in Position 4 des Phenylringes gebunden sind.

35

40



Ia

45

25

Außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel Ia, in der die Substituenten R¹ und R² und Q die oben genannte Bedeutung haben, X¹ für eine Gruppe für eine C₁-C₂-Alkylen- oder eine C₂-Alkinylengruppe steht und

5

Het eine drei- bis sechsgliedrige, teilweise oder vollständig gesättigte, heterocyclische Gruppe oder eine drei- bis sechsgliedrige heteroaromatische Gruppe mit bis zu drei Heteroatomen ausgewählt aus der Gruppe:

10

Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel,

wobei die genannte heterocyclische oder heteroaromatische Gruppe partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/15 oder durch R⁵ substituiert sein kann;

bedeutet.

Darüber hinaus sind die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel Ia außerordentlich bevorzugt, in der die Substituenten R¹, R² und X¹ die oben genannte Bedeutung haben und Het für eine fünf- oder sechsgliedrige, teilweise oder vollständig gesättigte heterocyclische oder eine fünf- oder sechsgliedrige heteroaromatische Gruppe mit bis zu drei Heteroatomen ausgewählt aus der 25 Gruppe

Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel

steht.

30

Insbesondere bevorzugt sind die Verbindungen Ib der Tabellen 1 bis 36.

35

40

45

Tabelle A

Nr.	X ¹	Het
5	1 CH ₂	Oxiranyl
	2 CH ₂	3-Methyl-2-oxiranyl
	3 CH ₂	2-Oxetanyl
10	4 CH ₂	3-Hydroxy-3-methyl-2-oxetanyl
	5 CH ₂	3-Hydroxy-3-ethyl-2-oxetanyl
	6 CH ₂	3-Hydroxy-3-propyl-2-oxetanyl
15	7 CH ₂	3-Hydroxy-3-butyl-2-oxetanyl
	8 CH ₂	3-Methoxy-3-methyl-2-oxetanyl
	9 CH ₂	3-Methoxy-3-ethyl-2-oxetanyl
20	10 CH ₂	3-Methoxy-3-propyl-2-oxetanyl
	11 CH ₂	3-Methoxy-3-butyl-2-oxetanyl
	12 CH ₂	3-Trimethylsilyloxy-3-methyl-2-oxetanyl
25	13 CH ₂	3-Trimethylsilyloxy-3-ethyl-2-oxetanyl
	14 CH ₂	3-Trimethylsilyloxy-3-propyl-2-oxetanyl
	15 CH ₂	3-Trimethylsilyloxy-3-butyl-2-oxetanyl
30	16 CH ₂	3-Oxetanyl
	17 CH ₂	2-Furyl
	18 CH ₂	4,5-Dihydro-2-furyl
35	19 CH ₂	2,3-Dihydro-2-furyl
	20 CH ₂	3-Furyl
	21 CH ₂	4,5-Dihydro-3-furyl
40	22 CH ₂	2,3-Dihydro-3-furyl
	23 CH ₂	2-Thienyl
	24 CH ₂	4,5-Dihydro-2-thienyl
45	25 CH ₂	2,3-Dihydro-2-thienyl
	26 CH ₂	5-Chlor-2-thienyl
	27 CH ₂	5-Methyl-2-thienyl
50	28 CH ₂	3-Thienyl
	29 CH ₂	4,5-Dihydro-3-thienyl
	30 CH ₂	2,3-Dihydro-3-thienyl
55	31 CH ₂	2-Pyrrolyl
	32 CH ₂	2,5-Dihydro-2-pyrrolyl
	33 CH ₂	3-Pyrrolyl

Nr.	X ¹	Het
34	CH ₂	2,5-Dihydro-3-pyrrolyl
35	CH ₂	3-Isoxazolyl
5	CH ₂	4-Methyl-3-isoxazolyl
36	CH ₂	5-Methyl-3-isoxazolyl
37	CH ₂	4,5-Dimethyl-3-isoxazolyl
10	CH ₂	4,5-Dihydro-3-isoxazolyl
38	CH ₂	4-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
39	CH ₂	5-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
15	CH ₂	4,5-Dimethyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
40	CH ₂	4-Isoxazolyl
41	CH ₂	3-Methyl-4-isoxazolyl
42	CH ₂	5-Cyclopropyl-4-isoxazolyl
20	CH ₂	5-Phenyl-4-isoxazolyl
43	CH ₂	3,5-Dimethyl-4-isoxazolyl
44	CH ₂	4,5-Dihydro-4-isoxazolyl
45	CH ₂	3-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
25	CH ₂	5-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
50	CH ₂	3,5-Dimethyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
51	CH ₂	5-Isoxazolyl
52	CH ₂	3-Methyl-5-isoxazolyl
30	CH ₂	4-Methyl-5-isoxazolyl
53	CH ₂	3,4-Dimethyl-5-isoxazolyl
54	CH ₂	4,5-Dihydro-5-isoxazolyl
35	CH ₂	3-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
55	CH ₂	4-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
56	CH ₂	3,4-Dimethyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
57	CH ₂	3-Methyl-4,5-dihydro-3-isothiazolyl
40	CH ₂	4-Methyl-4,5-dihydro-3-isothiazolyl
58	CH ₂	5-Methyl-4,5-dihydro-3-isothiazolyl
59	CH ₂	4,5-Dihydro-5-isothiazolyl
60	CH ₂	3-Methyl-4,5-dihydro-5-isothiazolyl
45	CH ₂	4-Methyl-4,5-dihydro-5-isothiazolyl
61	CH ₂	5-Methyl-4,5-dihydro-3-isothiazolyl
62	CH ₂	3,4-Dimethyl-4,5-dihydro-3-isothiazolyl
63	CH ₂	4-Methyl-3-isothiazolyl
64	CH ₂	5-Methyl-3-isothiazolyl
65	CH ₂	4-Isothiazolyl
66	CH ₂	3-Methyl-4-isothiazolyl
67	CH ₂	5-Methyl-4-isothiazolyl
68	CH ₂	3-Methyl-5-isothiazolyl

Nr.	X ¹	Het
69	CH ₂	4-Methyl-5-isothiazolyl
70	CH ₂	2-Oxazolyl
5 71	CH ₂	4-Oxazolyl
72	CH ₂	5-Oxazolyl
10 73	CH ₂	2-Thiazolyl
74	CH ₂	4-Thiazolyl
10 75	CH ₂	5-Thiazolyl
76	CH ₂	3-Pyrazolyl
15 77	CH ₂	4-Pyrazolyl
78	CH ₂	1-Methyl-3-pyrazolyl
15 79	CH ₂	1-Methyl-4-pyrazolyl
80	CH ₂	1-Methyl-5-pyrazolyl
20 81	CH ₂	2-Imidazolyl
82	CH ₂	1-Methyl-2-imidazolyl
83	CH ₂	5-Methyl-[1,3,4]-2-oxadiazolyl
20 84	CH ₂	5-Methyl-[1,2,4]-3-oxadiazolyl
85	CH ₂	5-Methyl-[1,3,4]-2-thiadiazolyl
25 86	CH ₂	5-Methyl-[1,2,4]-3-thiadiazolyl
87	CH ₂	[1,2,4]-3-triazolyl
88	CH ₂	[1,2,3]-4-triazolyl
30 89	CH ₂	2-Pyridyl
90	CH ₂	6-Chlor-2-pyridyl
91	CH ₂	6-Methoxy-2-pyridyl
92	CH ₂	6-Trifluormethyl-2-pyridyl
35 93	CH ₂	3-Pyridyl
94	CH ₂	2-Chlor-3-pyridyl
95	CH ₂	2-Methoxy-3-pyridyl
96	CH ₂	4-Pyridyl
40 97	CH ₂	2-Chlor-4-pyridyl
98	CH ₂	2-Methoxy-4-pyridyl
99	CH ₂	2-Ethoxy-4-pyridyl
100	CH ₂	2-Methylthio-4-pyridyl
45 101	CH ₂	2-Trifluormethyl-5-pyridyl
102	CH ₂	2-Pyrimidinyl
103	CH ₂	3-Pyrimidinyl

Nr.	X ¹	Het	
104	CH ₂	4-Pyrimidinyl	
105	CH ₂	2-Pyrazinyl	
5	106	3-Pyridazinyl	
107	CH ₂	4-Pyridazinyl	
108	CH ₂	2-(2H-1,3-oxazinyl)	
109	CH ₂	2-(6H-1,3-oxazinyl)	
10	110	4-(6H-1,3-oxazinyl)	
111	CH ₂	6-(6H-1,3-oxazinyl)	
112	CH ₂	[1,3,5]-2-Triazinyl	
15	113	[1,2,4]-3-Triazinyl	
114	CH ₂	[1,2,4]-5-Triazinyl	
115	CH ₂	[1,2,4]-6-Triazinyl	
20	116	CHCH ₃	Oxiranyl
117	CHCH ₃	3-Methyl-2-oxiranyl	
118	CHCH ₃	2-Oxetanyl	
119	CHCH ₃	3-Hydroxy-3-methyl-2-oxetanyl	
120	CHCH ₃	3-Hydroxy-3-ethyl-2-oxetanyl	
25	121	3-Hydroxy-3-propyl-2-oxetanyl	
122	CHCH ₃	3-Hydroxy-3-butyl-2-oxetanyl	
123	CHCH ₃	3-Methoxy-3-methyl-2-oxetanyl	
124	CHCH ₃	3-Methoxy-3-ethyl-2-oxetanyl	
30	125	3-Methoxy-3-propyl-2-oxetanyl	
126	CHCH ₃	3-Methoxy-3-butyl-2-oxetanyl	
127	CHCH ₃	3-Trimethylsilyloxy-3-methyl-2-oxetanyl	
35	128	3-Trimethylsilyloxy-3-ethyl-2-oxetanyl	
129	CHCH ₃	3-Trimethylsilyloxy-3-propyl-2-oxetanyl	
130	CHCH ₃	3-Trimethylsilyloxy-3-butyl-2-oxetanyl	
131	CHCH ₃	3-Oxetanyl	
40	132	CHCH ₃	2-Furyl
133	CHCH ₃	4,5-Dihydro-2-furyl	
134	CHCH ₃	2,3-Dihydro-2-furyl	
135	CHCH ₃	3-Furyl	
45	136	CHCH ₃	4,5-Dihydro-3-furyl
137	CHCH ₃	2,3-Dihydro-3-furyl	
138	CHCH ₃	2-Thienyl	

Nr.	X ¹	Het
139	CHCH ₃	4,5-Dihydro-2-thienyl
140	CHCH ₃	2,3-Dihydro-2-thienyl
5	141	5-Chlor-2-thienyl
142	CHCH ₃	5-Methyl-2-thienyl
10	143	3-Thienyl
144	CHCH ₃	4,5-Dihydro-3-thienyl
145	CHCH ₃	2,3-Dihydro-3-thienyl
146	CHCH ₃	2-Pyrrolyl
15	147	2,5-Dihydro-2-pyrrolyl
148	CHCH ₃	3-Pyrrolyl
149	CHCH ₃	2,5-Dihydro-3-pyrrolyl
150	CHCH ₃	3-Isoxazolyl
20	151	4-Methyl-3-isoxazolyl
152	CHCH ₃	5-Methyl-3-isoxazolyl
153	CHCH ₃	4,5-Dimethyl-3-isoxazolyl
154	CHCH ₃	4,5-Dihydro-3-isoxazolyl
25	155	4-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
156	CHCH ₃	5-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
157	CHCH ₃	4,5-Dimethyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
158	CHCH ₃	4-Isoxazolyl
30	159	3-Methyl-4-isoxazolyl
160	CHCH ₃	5-Methyl-4-isoxazolyl
161	CHCH ₃	5-Cyclopropyl-4-isoxazolyl
162	CHCH ₃	5-Phenyl-4-isoxazolyl
35	163	3,5-Dimethyl-4-isoxazolyl
164	CHCH ₃	4,5-Dihydro-4-isoxazolyl
165	CHCH ₃	3-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
166	CHCH ₃	5-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
40	167	3,5-Dimethyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
168	CHCH ₃	5-Isoxazolyl
169	CHCH ₃	3-Methyl-5-isoxazolyl
170	CHCH ₃	4-Methyl-5-isoxazolyl
45	171	3,4-Dimethyl-5-isoxazolyl
172	CHCH ₃	4,5-Dihydro-5-isoxazolyl
173	CHCH ₃	3-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl

Nr.	X ⁱ	Het
174	CHCH ₃	4-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
175	CHCH ₃	3,4-Dimethyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
5	176	3-Isothiazolyl
177	CHCH ₃	4-Methyl-3-isothiazolyl
178	CHCH ₃	5-Methyl-3-isothiazolyl
10	179	4-Isothiazolyl
180	CHCH ₃	3-Methyl-4-isothiazolyl
181	CHCH ₃	5-Methyl-4-isothiazolyl
182	CHCH ₃	5-Isothiazolyl
15	183	3-Methyl-5-isothiazolyl
184	CHCH ₃	4-Methyl-5-isothiazolyl
185	CHCH ₃	2-Oxazolyl
186	CHCH ₃	4-Oxazolyl
20	187	5-Oxazolyl
188	CHCH ₃	2-Thiazolyl
189	CHCH ₃	4-Thiazolyl
190	CHCH ₃	5-Thiazolyl
25	191	3-Pyrazolyl
192	CHCH ₃	4-Pyrazolyl
193	CHCH ₃	1-Methyl-3-pyrazolyl
194	CHCH ₃	1-Methyl-4-pyrazolyl
30	195	1-Methyl-5-pyrazolyl
196	CHCH ₃	2-Imidazolyl
197	CHCH ₃	1-Methyl-2-imidazolyl
35	198	5-Methyl-[1,3,4]-2-oxadiazolyl
199	CHCH ₃	5-Methyl-[1,2,4]-3-oxadiazolyl
200	CHCH ₃	5-Methyl-[1,3,4]-2-thiadiazolyl
201	CHCH ₃	5-Methyl-[1,2,4]-3-thiadiazolyl
40	202	[1,2,4]-3-triazolyl
203	CHCH ₃	[1,2,3]-4-triazolyl
204	CHCH ₃	2-Pyridyl
205	CHCH ₃	6-Chlor-2-pyridyl
45	206	6-Methoxy-2-pyridyl
207	CHCH ₃	6-Trifluormethyl-2-pyridyl
208	CHCH ₃	3-Pyridyl

Nr.	X ¹	Het
209	CHCH ₃	2-Chlor-3-pyridyl
210	CHCH ₃	2-Methoxy-3-pyridyl
5	211	4-Pyridyl
	212	2-Chlor-4-pyridyl
	213	2-Methoxy-4-pyridyl
10	214	2-Ethoxy-4-pyridyl
	215	2-Methylthio-4-pyridyl
	216	2-Trifluormethyl-5-pyridyl
15	217	2-Pyrimidinyl
	218	3-Pyrimidinyl
	219	4-Pyrimidinyl
	220	2-Pyrazinyl
20	221	3-Pyridazinyl
	222	4-Pyridazinyl
	223	2-(2H-1,3-oxazinyl)
	224	2-(6H-1,3-oxazinyl)
25	225	4-(6H-1,3-oxazinyl)
	226	6-(6H-1,3-oxazinyl)
	227	[1,3,5]-2-Triazinyl
	228	[1,2,4]-3-Triazinyl
30	229	[1,2,4]-5-Triazinyl
	230	[1,2,4]-6-Triazinyl
	231	Oxiranyl
	232	3-Methyl-2-oxiranyl
35	233	2-Oxetanyl
	234	3-Hydroxy-3-methyl-2-oxetanyl
	235	3-Hydroxy-3-ethyl-2-oxetanyl
	236	3-Hydroxy-3-propyl-2-oxetanyl
40	237	3-Hydroxy-3-butyl-2-oxetanyl
	238	3-Methoxy-3-methyl-2-oxetanyl
	239	3-Methoxy-3-ethyl-2-oxetanyl
	240	3-Methoxy-3-propyl-2-oxetanyl
45	241	3-Methoxy-3-butyl-2-oxetanyl
	242	3-Trimethylsilyloxy-3-methyl-2-oxetanyl
	243	3-Trimethylsilyloxy-3-ethyl-2-oxetanyl

Nr.	X ¹	Het
5	244 CHOH	3-Trimethylsilyloxy-3-propyl-2-oxetanyl
	245 CHOH	3-Trimethylsilyloxy-3-butyl-2-oxetanyl
	246 CHOH	3-Oxetanyl
	247 CHOH	2-Furyl
	248 CHOH	4,5-Dihydro-2-furyl
	249 CHOH	2,3-Dihydro-2-furyl
	250 CHOH	3-Furyl
10	251 CHOH	4,5-Dihydro-3-furyl
	252 CHOH	2,3-Dihydro-3-furyl
	253 CHOH	2-Thienyl
	254 CHOH	4,5-Dihydro-2-thienyl
	255 CHOH	2,3-Dihydro-2-thienyl
	256 CHOH	5-Chlor-2-thienyl
	257 CHOH	5-Methyl-2-thienyl
15	258 CHOH	3-Thienyl
	259 CHOH	4,5-Dihydro-3-thienyl
	260 CHOH	2,3-Dihydro-3-thienyl
	261 CHOH	2-Pyrrolyl
	262 CHOH	2,5-Dihydro-2-pyrrolyl
	263 CHOH	3-Pyrrolyl
	264 CHOH	2,5-Dihydro-3-pyrrolyl
20	265 CHOH	3-Isoxazolyl
	266 CHOH	4-Methyl-3-isoxazolyl
	267 CHOH	5-Methyl-3-isoxazolyl
	268 CHOH	4,5-Dimethyl-3-isoxazolyl
	269 CHOH	4,5-Dihydro-3-isoxazolyl
	270 CHOH	4-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
	271 CHOH	5-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
25	272 CHOH	4,5-Dimethyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
	273 CHOH	4-Isoxazolyl
	274 CHOH	3-Methyl-4-isoxazolyl
	275 CHOH	5-Methyl-4-isoxazolyl
	276 CHOH	5-Cyclopropyl-4-isoxazolyl
	277 CHOH	5-Phenyl-4-isoxazolyl
	278 CHOH	3,5-Dimethyl-4-isoxazolyl

Nr.	X ¹	Het
279	CHOH	4,5-Dihydro-4-isoxazolyl
280	CHOH	3-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
281	CHOH	5-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
282	CHOH	3,5-Dimethyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
283	CHOH	5-Isoxazolyl
284	CHOH	3-Methyl-5-isoxazolyl
285	CHOH	4-Methyl-5-isoxazolyl
286	CHOH	3,4-Dimethyl-5-isoxazolyl
287	CHOH	4,5-Dihydro-5-isoxazolyl
288	CHOH	3-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
289	CHOH	4-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
290	CHOH	3,4-Dimethyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
291	CHOH	3-Iothiazolyl
292	CHOH	4-Methyl-3-isothiazolyl
293	CHOH	5-Methyl-3-isothiazolyl
294	CHOH	4-Iothiazolyl
295	CHOH	3-Methyl-4-isothiazolyl
296	CHOH	5-Methyl-4-isothiazolyl
297	CHOH	5-Iothiazolyl
298	CHOH	3-Methyl-5-isothiazolyl
299	CHOH	4-Methyl-5-isothiazolyl
300	CHOH	2-Oxazolyl
301	CHOH	4-Oxazolyl
302	CHOH	5-Oxazolyl
303	CHOH	2-Thiazolyl
304	CHOH	4-Thiazolyl
305	CHOH	5-Thiazolyl
306	CHOH	3-Pyrazolyl
307	CHOH	4-Pyrazolyl
308	CHOH	1-Methyl-3-pyrazolyl
309	CHOH	1-Methyl-4-pyrazolyl
310	CHOH	1-Methyl-5-pyrazolyl
311	CHOH	2-Imidazolyl
312	CHOH	1-Methyl-2-imidazolyl
313	CHOH	5-Methyl-[1,3,4]-2-oxadiazolyl

Nr.	X ¹	Het
314	CHOH	5-Methyl-[1,2,4]-3-oxadiazolyl
315	CHOH	5-Methyl-[1,3,4]-2-thiadiazolyl
5 316	CHOH	5-Methyl-[1,2,4]-3-thiadiazolyl
317	CHOH	[1,2,4]-3-triazolyl
10 318	CHOH	[1,2,3]-4-triazolyl
319	CHOH	2-Pyridyl
15 320	CHOH	6-Chlor-2-pyridyl
321	CHOH	6-Methoxy-2-pyridyl
322	CHOH	6-Trifluormethyl-2-pyridyl
15 323	CHOH	3-Pyridyl
324	CHOH	2-Chlor-3-pyridyl
325	CHOH	2-Methoxy-3-pyridyl
20 326	CHOH	4-Pyridyl
327	CHOH	2-Chlor-4-pyridyl
328	CHOH	2-Methoxy-4-pyridyl
329	CHOH	2-Ethoxy-4-pyridyl
330	CHOH	2-Methylthio-4-pyridyl
25 331	CHOH	2-Trifluormethyl-5-pyridyl
332	CHOH	2-Pyrimidinyl
333	CHOH	3-Pyrimidinyl
334	CHOH	4-Pyrimidinyl
30 335	CHOH	2-Pyrazinyl
336	CHOH	3-Pyridazinyl
337	CHOH	4-Pyridazinyl
35 338	CHOH	2-(2H-1,3-oxazinyl)
339	CHOH	2-(6H-1,3-oxazinyl)
340	CHOH	4-(6H-1,3-oxazinyl)
341	CHOH	6-(6H-1,3-oxazinyl)
40 342	CHOH	[1,3,5]-2-Triazinyl
343	CHOH	[1,2,4]-3-Triazinyl
344	CHOH	[1,2,4]-5-Triazinyl
345	CHOH	[1,2,4]-6-Triazinyl
45 346	CH ₃ OCH ₃	Oxiranyl
347	CH ₃ OCH ₃	3-Methyl-2-oxiranyl
348	CH ₃ OCH ₃	2-Oxetanyl

Nr.	X ¹	Het
349	CHOCH ₃	3-Hydroxy-3-methyl-2-oxetanyl
350	CHOCH ₃	3-Hydroxy-3-ethyl-2-oxetanyl
5	351	3-Hydroxy-3-propyl-2-oxetanyl
352	CHOCH ₃	3-Hydroxy-3-butyl-2-oxetanyl
10	353	3-Methoxy-3-methyl-2-oxetanyl
354	CHOCH ₃	3-Methoxy-3-ethyl-2-oxetanyl
15	355	3-Methoxy-3-propyl-2-oxetanyl
356	CHOCH ₃	3-Methoxy-3-butyl-2-oxetanyl
357	CHOCH ₃	3-Trimethylsilyloxy-3-methyl-2-oxetanyl
20	358	3-Trimethylsilyloxy-3-ethyl-2-oxetanyl
359	CHOCH ₃	3-Trimethylsilyloxy-3-propyl-2-oxetanyl
360	CHOCH ₃	3-Trimethylsilyloxy-3-butyl-2-oxetanyl
361	CHOCH ₃	3-Oxetanyl
25	362	2-Furyl
363	CHOCH ₃	4,5-Dihydro-2-furyl
364	CHOCH ₃	2,3-Dihydro-2-furyl
365	CHOCH ₃	3-Furyl
30	366	4,5-Dihydro-3-furyl
367	CHOCH ₃	2,3-Dihydro-3-furyl
368	CHOCH ₃	2-Thienyl
369	CHOCH ₃	4,5-Dihydro-2-thienyl
370	CHOCH ₃	2,3-Dihydro-2-thienyl
371	CHOCH ₃	5-Chlor-2-thienyl
372	CHOCH ₃	5-Methyl-2-thienyl
35	373	3-Thienyl
374	CHOCH ₃	4,5-Dihydro-3-thienyl
375	CHOCH ₃	2,3-Dihydro-3-thienyl
376	CHOCH ₃	2-Pyrrolyl
40	377	2,5-Dihydro-2-pyrrolyl
378	CHOCH ₃	3-Pyrrolyl
379	CHOCH ₃	2,5-Dihydro-3-pyrrolyl
380	CHOCH ₃	3-Isoxazolyl
45	381	4-Methyl-3-isoxazolyl
382	CHOCH ₃	5-Methyl-3-isoxazolyl
383	CHOCH ₃	4,5-Dimethyl-3-isoxazolyl

Nr.	X ¹	Het
384	CHOCH ₃	4,5-Dihydro-3-isoxazolyl
385	CHOCH ₃	4-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
386	CHOCH ₃	5-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
387	CHOCH ₃	4,5-Dimethyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
388	CHOCH ₃	4-Isoxazolyl
389	CHOCH ₃	3-Methyl-4-isoxazolyl
390	CHOCH ₃	5-Methyl-4-isoxazolyl
391	CHOCH ₃	5-Cyclopropyl-4-isoxazolyl
392	CHOCH ₃	5-Phenyl-4-isoxazolyl
393	CHOCH ₃	3,5-Dimethyl-4-isoxazolyl
394	CHOCH ₃	4,5-Dihydro-4-isoxazolyl
395	CHOCH ₃	3-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
396	CHOCH ₃	5-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
397	CHOCH ₃	3,5-Dimethyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
398	CHOCH ₃	5-Isoxazolyl
399	CHOCH ₃	3-Methyl-5-isoxazolyl
400	CHOCH ₃	4-Methyl-5-isoxazolyl
401	CHOCH ₃	3,4-Dimethyl-5-isoxazolyl
402	CHOCH ₃	4,5-Dihydro-5-isoxazolyl
403	CHOCH ₃	3-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
404	CHOCH ₃	4-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
405	CHOCH ₃	3,4-Dimethyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
406	CHOCH ₃	3-Iothiazolyl
407	CHOCH ₃	4-Methyl-3-isothiazolyl
408	CHOCH ₃	5-Methyl-3-isothiazolyl
409	CHOCH ₃	4-Iothiazolyl
410	CHOCH ₃	3-Methyl-4-isothiazolyl
411	CHOCH ₃	5-Methyl-4-isothiazolyl
412	CHOCH ₃	5-Iothiazolyl
413	CHOCH ₃	3-Methyl-5-isothiazolyl
414	CHOCH ₃	4-Methyl-5-isothiazolyl
415	CHOCH ₃	2-Oxazolyl
416	CHOCH ₃	4-Oxazolyl
417	CHOCH ₃	5-Oxazolyl
418	CHOCH ₃	2-Thiazolyl

Nr.	X ¹	Het
5	419 CHOCH ₃	4-Thiazolyl
	420 CHOCH ₃	5-Thiazolyl
	421 CHOCH ₃	3-Pyrazolyl
	422 CHOCH ₃	4-Pyrazolyl
	423 CHOCH ₃	1-Methyl-3-pyrazolyl
10	424 CHOCH ₃	1-Methyl-4-pyrazolyl
	425 CHOCH ₃	1-Methyl-5-pyrazolyl
	426 CHOCH ₃	2-Imidazolyl
	427 CHOCH ₃	1-Methyl-2-imidazolyl
	428 CHOCH ₃	5-Methyl-[1,3,4]-2-oxadiazolyl
15	429 CHOCH ₃	5-Methyl-[1,2,4]-3-oxadiazolyl
	430 CHOCH ₃	5-Methyl-[1,3,4]-2-thiadiazolyl
	431 CHOCH ₃	5-Methyl-[1,2,4]-3-thiadiazolyl
	432 CHOCH ₃	[1,2,4]-3-triazolyl
	433 CHOCH ₃	[1,2,3]-4-triazolyl
20	434 CHOCH ₃	2-Pyridyl
	435 CHOCH ₃	6-Chlor-2-pyridyl
	436 CHOCH ₃	6-Methoxy-2-pyridyl
	437 CHOCH ₃	6-Trifluormethyl-2-pyridyl
	438 CHOCH ₃	3-Pyridyl
25	439 CHOCH ₃	2-Chlor-3-pyridyl
	440 CHOCH ₃	2-Methoxy-3-pyridyl
	441 CHOCH ₃	4-Pyridyl
	442 CHOCH ₃	2-Chlor-4-pyridyl
	443 CHOCH ₃	2-Methoxy-4-pyridyl
30	444 CHOCH ₃	2-Ethoxy-4-pyridyl
	445 CHOCH ₃	2-Methylthio-4-pyridyl
	446 CHOCH ₃	2-Trifluormethyl-5-pyridyl
	447 CHOCH ₃	2-Pyrimidinyl
	448 CHOCH ₃	3-Pyrimidinyl
35	449 CHOCH ₃	4-Pyrimidinyl
	450 CHOCH ₃	2-Pyrazinyl
	451 CHOCH ₃	3-Pyridazinyl
	452 CHOCH ₃	4-Pyridazinyl
	453 CHOCH ₃	2-(2H-1,3-oxazinyl)

Nr.	X ¹	Het
454	CHOCH ₃	2-(6H-1,3-oxazinyl)
455	CHOCH ₃	4-(6H-1,3-oxazinyl)
5 456	CHOCH ₃	6-(6H-1,3-oxazinyl)
457	CHOCH ₃	[1,3,5]-2-Triazinyl
10 458	CHOCH ₃	[1,2,4]-3-Triazinyl
459	CHOCH ₃	[1,2,4]-5-Triazinyl
15 460	CHOCH ₃	[1,2,4]-6-Triazinyl
461	CHOCOCH ₃	Oxiranyl
462	CHOCOCH ₃	3-Methyl-2-oxiranyl
15 463	CHOCOCH ₃	2-Oxetanyl
464	CHOCOCH ₃	3-Hydroxy-3-methyl-2-oxetanyl
20 465	CHOCOCH ₃	3-Hydroxy-3-ethyl-2-oxetanyl
466	CHOCOCH ₃	3-Hydroxy-3-propyl-2-oxetanyl
20 467	CHOCOCH ₃	3-Hydroxy-3-butyl-2-oxetanyl
468	CHOCOCH ₃	3-Methoxy-3-methyl-2-oxetanyl
469	CHOCOCH ₃	3-Methoxy-3-ethyl-2-oxetanyl
25 470	CHOCOCH ₃	3-Methoxy-3-propyl-2-oxetanyl
471	CHOCOCH ₃	3-Methoxy-3-butyl-2-oxetanyl
472	CHOCOCH ₃	3-Trimethylsilyloxy-3-methyl-2-oxetanyl
473	CHOCOCH ₃	3-Trimethylsilyloxy-3-ethyl-2-oxetanyl
30 474	CHOCOCH ₃	3-Trimethylsilyloxy-3-propyl-2-oxetanyl
475	CHOCOCH ₃	3-Trimethylsilyloxy-3-butyl-2-oxetanyl
476	CHOCOCH ₃	3-Oxetanyl
35 477	CHOCOCH ₃	2-Furyl
478	CHOCOCH ₃	4,5-Dihydro-2-furyl
479	CHOCOCH ₃	2,3-Dihydro-2-furyl
35 480	CHOCOCH ₃	3-Furyl
481	CHOCOCH ₃	4,5-Dihydro-3-furyl
40 482	CHOCOCH ₃	2,3-Dihydro-3-furyl
483	CHOCOCH ₃	2-Thienyl
484	CHOCOCH ₃	4,5-Dihydro-2-thienyl
485	CHOCOCH ₃	2,3-Dihydro-2-thienyl
45 486	CHOCOCH ₃	5-Chlor-2-thienyl
487	CHOCOCH ₃	5-Methyl-2-thienyl
488	CHOCOCH ₃	3-Thienyl

Nr.	X ⁱ	Het	
489	CHOCOCH ₃	4,5-Dihydro-3-thienyl	
490	CHOCOCH ₃	2,3-Dihydro-3-thienyl	
5	491	CHOCOCH ₃	2-Pyrrolyl
	492	CHOCOCH ₃	2,5-Dihydro-2-pyrrolyl
10	493	CHOCOCH ₃	3-Pyrrolyl
	494	CHOCOCH ₃	2,5-Dihydro-3-pyrrolyl
15	495	CHOCOCH ₃	3-Isoxazolyl
	496	CHOCOCH ₃	4-Methyl-3-isoxazolyl
	497	CHOCOCH ₃	5-Methyl-3-isoxazolyl
20	498	CHOCOCH ₃	4,5-Dimethyl-3-isoxazolyl
	499	CHOCOCH ₃	4,5-Dihydro-3-isoxazolyl
	500	CHOCOCH ₃	4-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
	501	CHOCOCH ₃	5-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
25	502	CHOCOCH ₃	4,5-Dimethyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
	503	CHOCOCH ₃	4-Isoxazolyl
	504	CHOCOCH ₃	3-Methyl-4-isoxazolyl
	505	CHOCOCH ₃	5-Methyl-4-isoxazolyl
30	506	CHOCOCH ₃	5-Cyclopropyl-4-isoxazolyl
	507	CHOCOCH ₃	5-Phenyl-4-isoxazolyl
	508	CHOCOCH ₃	3,5-Dimethyl-4-isoxazolyl
	509	CHOCOCH ₃	4,5-Dihydro-4-isoxazolyl
35	510	CHOCOCH ₃	3-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
	511	CHOCOCH ₃	5-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
	512	CHOCOCH ₃	3,5-Dimethyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
40	513	CHOCOCH ₃	5-Isoxazolyl
	514	CHOCOCH ₃	3-Methyl-5-isoxazolyl
	515	CHOCOCH ₃	4-Methyl-5-isoxazolyl
	516	CHOCOCH ₃	3,4-Dimethyl-5-isoxazolyl
45	517	CHOCOCH ₃	4,5-Dihydro-5-isoxazolyl
	518	CHOCOCH ₃	3-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
	519	CHOCOCH ₃	4-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
	520	CHOCOCH ₃	3,4-Dimethyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
	521	CHOCOCH ₃	3-Iothiazolyl
	522	CHOCOCH ₃	4-Methyl-3-isothiazolyl
	523	CHOCOCH ₃	5-Methyl-3-isothiazolyl

Nr.	X [†]	Het
524	CHOCOCH ₃	4-Isothiazolyl
525	CHOCOCH ₃	3-Methyl-4-isothiazolyl
526	CHOCOCH ₃	5-Methyl-4-isothiazolyl
527	CHOCOCH ₃	5-Isothiazolyl
528	CHOCOCH ₃	3-Methyl-5-isothiazolyl
529	CHOCOCH ₃	4-Methyl-5-isothiazolyl
530	CHOCOCH ₃	2-Oxazolyl
531	CHOCOCH ₃	4-Oxazolyl
532	CHOCOCH ₃	5-Oxazolyl
533	CHOCOCH ₃	2-Thiazolyl
534	CHOCOCH ₃	4-Thiazolyl
535	CHOCOCH ₃	5-Thiazolyl
536	CHOCOCH ₃	3-Pyrazolyl
537	CHOCOCH ₃	4-Pyrazolyl
538	CHOCOCH ₃	1-Methyl-3-pyrazolyl
539	CHOCOCH ₃	1-Methyl-4-pyrazolyl
540	CHOCOCH ₃	1-Methyl-5-pyrazolyl
541	CHOCOCH ₃	2-Imidazolyl
542	CHOCOCH ₃	1-Methyl-2-imidazolyl
543	CHOCOCH ₃	5-Methyl-[1,3,4]-2-oxadiazolyl
544	CHOCOCH ₃	5-Methyl-[1,2,4]-3-oxadiazolyl
545	CHOCOCH ₃	5-Methyl-[1,3,4]-2-thiadiazolyl
546	CHOCOCH ₃	5-Methyl-[1,2,4]-3-thiadiazolyl
547	CHOCOCH ₃	[1,2,4]-3-triazolyl
548	CHOCOCH ₃	[1,2,3]-4-triazolyl
549	CHOCOCH ₃	2-Pyridyl
550	CHOCOCH ₃	6-Chlor-2-pyridyl
551	CHOCOCH ₃	6-Methoxy-2-pyridyl
552	CHOCOCH ₃	6-Trifluormethyl-2-pyridyl
553	CHOCOCH ₃	3-Pyridyl
554	CHOCOCH ₃	2-Chlor-3-pyridyl
555	CHOCOCH ₃	2-Methoxy-3-pyridyl
556	CHOCOCH ₃	4-Pyridyl
557	CHOCOCH ₃	2-Chlor-4-pyridyl
558	CHOCOCH ₃	2-Methoxy-4-pyridyl

Nr.	X ¹	Het
5	559 CHOCOCH ₃	2-Ethoxy-4-pyridyl
	560 CHOCOCH ₃	2-Methylthio-4-pyridyl
	561 CHOCOCH ₃	2-Trifluormethyl-5-pyridyl
	562 CHOCOCH ₃	2-Pyrimidinyl
	563 CHOCOCH ₃	3-Pyrimidinyl
10	564 CHOCOCH ₃	4-Pyrimidinyl
	565 CHOCOCH ₃	2-Pyrazinyl
	566 CHOCOCH ₃	3-Pyridazinyl
	567 CHOCOCH ₃	4-Pyridazinyl
	568 CHOCOCH ₃	2-(2H-1,3-oxazinyl)
15	569 CHOCOCH ₃	2-(6H-1,3-oxazinyl)
	570 CHOCOCH ₃	4-(6H-1,3-oxazinyl)
	571 CHOCOCH ₃	6-(6H-1,3-oxazinyl)
	572 CHOCOCH ₃	[1,3,5]-2-Triazinyl
	573 CHOCOCH ₃	[1,2,4]-3-Triazinyl
20	574 CHOCOCH ₃	[1,2,4]-5-Triazinyl
	575 CHOCOCH ₃	[1,2,4]-6-Triazinyl
	576 CHOSO ₂ CH ₃	Oxiranyl
	577 CHOSO ₂ CH ₃	3-Methyl-2-oxiranyl
	578 CHOSO ₂ CH ₃	2-Ozetanyl
25	579 CHOSO ₂ CH ₃	3-Hydroxy-3-methyl-2-oxetanyl
	580 CHOSO ₂ CH ₃	3-Hydroxy-3-ethyl-2-oxetanyl
	581 CHOSO ₂ CH ₃	3-Hydroxy-3-propyl-2-oxetanyl
	582 CHOSO ₂ CH ₃	3-Hydroxy-3-butyl-2-oxetanyl
	583 CHOSO ₂ CH ₃	3-Methoxy-3-methyl-2-oxetanyl
30	584 CHOSO ₂ CH ₃	3-Methoxy-3-ethyl-2-oxetanyl
	585 CHOSO ₂ CH ₃	3-Methoxy-3-propyl-2-oxetanyl
	586 CHOSO ₂ CH ₃	3-Methoxy-3-butyl-2-oxetanyl
	587 CHOSO ₂ CH ₃	3-Trimethylsilyloxy-3-methyl-2-oxetanyl
	588 CHOSO ₂ CH ₃	3-Trimethylsilyloxy-3-ethyl-2-oxetanyl
35	589 CHOSO ₂ CH ₃	3-Trimethylsilyloxy-3-propyl-2-oxetanyl
	590 CHOSO ₂ CH ₃	3-Trimethylsilyloxy-3-butyl-2-oxetanyl
	591 CHOSO ₂ CH ₃	3-Ozetanyl
	592 CHOSO ₂ CH ₃	2-Furyl
	593 CHOSO ₂ CH ₃	4,5-Dihydro-2-furyl

Nr.	X ⁱ	Het
594	CHOSO ₂ CH ₃	2,3-Dihydro-2-furyl
595	CHOSO ₂ CH ₃	3-Furyl
596	CHOSO ₂ CH ₃	4,5-Dihydro-3-furyl
597	CHOSO ₂ CH ₃	2,3-Dihydro-3-furyl
598	CHOSO ₂ CH ₃	2-Thienyl
599	CHOSO ₂ CH ₃	4,5-Dihydro-2-thienyl
600	CHOSO ₂ CH ₃	2,3-Dihydro-2-thienyl
601	CHOSO ₂ CH ₃	5-Chlor-2-thienyl
602	CHOSO ₂ CH ₃	5-Methyl-2-thienyl
603	CHOSO ₂ CH ₃	3-Thienyl
604	CHOSO ₂ CH ₃	4,5-Dihydro-3-thienyl
605	CHOSO ₂ CH ₃	2,3-Dihydro-3-thienyl
606	CHOSO ₂ CH ₃	2-Pyrrolyl
607	CHOSO ₂ CH ₃	2,5-Dihydro-2-pyrrolyl
608	CHOSO ₂ CH ₃	3-Pyrrolyl
609	CHOSO ₂ CH ₃	2,5-Dihydro-3-pyrrolyl
610	CHOSO ₂ CH ₃	3-Isoxazolyl
611	CHOSO ₂ CH ₃	4-Methyl-3-isoxazolyl
612	CHOSO ₂ CH ₃	5-Methyl-3-isoxazolyl
613	CHOSO ₂ CH ₃	4,5-Dimethyl-3-isoxazolyl
614	CHOSO ₂ CH ₃	4,5-Dihydro-3-isoxazolyl
615	CHOSO ₂ CH ₃	4-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
616	CHOSO ₂ CH ₃	5-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
617	CHOSO ₂ CH ₃	4,5-Dimethyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
618	CHOSO ₂ CH ₃	4-Isoxazolyl
619	CHOSO ₂ CH ₃	3-Methyl-4-isoxazolyl
620	CHOSO ₂ CH ₃	5-Methyl-4-isoxazolyl
621	CHOSO ₂ CH ₃	5-Cyclopropyl-4-isoxazolyl
622	CHOSO ₂ CH ₃	5-Phenyl-4-isoxazolyl
623	CHOSO ₂ CH ₃	3,5-Dimethyl-4-isoxazolyl
624	CHOSO ₂ CH ₃	4,5-Dihydro-4-isoxazolyl
625	CHOSO ₂ CH ₃	3-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
626	CHOSO ₂ CH ₃	5-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
627	CHOSO ₂ CH ₃	3,5-Dimethyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
628	CHOSO ₂ CH ₃	5-Isoxazolyl

Nr.	X ⁱ	Het
629	CHOSO ₂ CH ₃	3-Methyl-5-isoxazolyl
630	CHOSO ₂ CH ₃	4-Methyl-5-isoxazolyl
5 631	CHOSO ₂ CH ₃	3,4-Dimethyl-5-isoxazolyl
632	CHOSO ₂ CH ₃	4,5-Dihydro-5-isoxazolyl
10 633	CHOSO ₂ CH ₃	3-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
634	CHOSO ₂ CH ₃	4-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
15 635	CHOSO ₂ CH ₃	3,4-Dimethyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
636	CHOSO ₂ CH ₃	3-Iothiazolyl
637	CHOSO ₂ CH ₃	4-Methyl-3-isothiazolyl
15 638	CHOSO ₂ CH ₃	5-Methyl-3-isothiazolyl
639	CHOSO ₂ CH ₃	4-Iothiazolyl
20 640	CHOSO ₂ CH ₃	3-Methyl-4-isothiazolyl
641	CHOSO ₂ CH ₃	5-Methyl-4-isothiazolyl
20 642	CHOSO ₂ CH ₃	5-Iothiazolyl
643	CHOSO ₂ CH ₃	3-Methyl-5-isothiazolyl
644	CHOSO ₂ CH ₃	4-Methyl-5-isothiazolyl
25 645	CHOSO ₂ CH ₃	2-Oxazolyl
646	CHOSO ₂ CH ₃	4-Oxazolyl
647	CHOSO ₂ CH ₃	5-Oxazolyl
648	CHOSO ₂ CH ₃	2-Thiazolyl
30 649	CHOSO ₂ CH ₃	4-Thiazolyl
650	CHOSO ₂ CH ₃	5-Thiazolyl
651	CHOSO ₂ CH ₃	3-Pyrazolyl
35 652	CHOSO ₂ CH ₃	4-Pyrazolyl
653	CHOSO ₂ CH ₃	1-Methyl-3-pyrazolyl
35 654	CHOSO ₂ CH ₃	1-Methyl-4-pyrazolyl
655	CHOSO ₂ CH ₃	1-Methyl-5-pyrazolyl
40 656	CHOSO ₂ CH ₃	2-Imidazolyl
657	CHOSO ₂ CH ₃	1-Methyl-2-imidazolyl
658	CHOSO ₂ CH ₃	5-Methyl-[1,3,4]-2-oxadiazolyl
659	CHOSO ₂ CH ₃	5-Methyl-[1,2,4]-3-oxadiazolyl
45 660	CHOSO ₂ CH ₃	5-Methyl-[1,3,4]-2-thiadiazolyl
661	CHOSO ₂ CH ₃	5-Methyl-[1,2,4]-3-thiadiazolyl
662	CHOSO ₂ CH ₃	[1,2,4]-3-triazolyl
663	CHOSO ₂ CH ₃	[1,2,3]-4-triazolyl

Nr.	X ¹	Het
664	CHOSO ₂ CH ₃	2-Pyridyl
665	CHOSO ₂ CH ₃	6-Chlor-2-pyridyl
666	CHOSO ₂ CH ₃	6-Methoxy-2-pyridyl
667	CHOSO ₂ CH ₃	6-Trifluormethyl-2-pyridyl
668	CHOSO ₂ CH ₃	3-Pyridyl
669	CHOSO ₂ CH ₃	2-Chlor-3-pyridyl
670	CHOSO ₂ CH ₃	2-Methoxy-3-pyridyl
671	CHOSO ₂ CH ₃	4-Pyridyl
672	CHOSO ₂ CH ₃	2-Chlor-4-pyridyl
673	CHOSO ₂ CH ₃	2-Methoxy-4-pyridyl
674	CHOSO ₂ CH ₃	2-Ethoxy-4-pyridyl
675	CHOSO ₂ CH ₃	2-Methylthio-4-pyridyl
676	CHOSO ₂ CH ₃	2-Trifluormethyl-5-pyridyl
677	CHOSO ₂ CH ₃	2-Pyrimidinyl
678	CHOSO ₂ CH ₃	3-Pyrimidinyl
679	CHOSO ₂ CH ₃	4-Pyrimidinyl
680	CHOSO ₂ CH ₃	2-Pyrazinyl
681	CHOSO ₂ CH ₃	3-Pyridazinyl
682	CHOSO ₂ CH ₃	4-Pyridazinyl
683	CHOSO ₂ CH ₃	2-(2H-1,3-oxazinyl)
684	CHOSO ₂ CH ₃	2-(6H-1,3-oxazinyl)
685	CHOSO ₂ CH ₃	4-(6H-1,3-oxazinyl)
686	CHOSO ₂ CH ₃	6-(6H-1,3-oxazinyl)
687	CHOSO ₂ CH ₃	[1,3,5]-2-Triazinyl
688	CHOSO ₂ CH ₃	[1,2,4]-3-Triazinyl
689	CHOSO ₂ CH ₃	[1,2,4]-5-Triazinyl
690	CHOSO ₂ CH ₃	[1,2,4]-6-Triazinyl
691	CH ₂ CH ₂	Oxiranyl
692	CH ₂ CH ₂	3-Methyl-2-oxiranyl
693	CH ₂ CH ₂	2-Oxetanyl
694	CH ₂ CH ₂	3-Hydroxy-3-methyl-2-oxetanyl
695	CH ₂ CH ₂	3-Hydroxy-3-ethyl-2-oxetanyl
696	CH ₂ CH ₂	3-Hydroxy-3-propyl-2-oxetanyl
697	CH ₂ CH ₂	3-Hydroxy-3-butyl-2-oxetanyl
698	CH ₂ CH ₂	3-Methoxy-3-methyl-2-oxetanyl

Nr.	X ¹	Het
699	CH ₂ CH ₂	3-Methoxy-3-ethyl-2-oxetanyl
700	CH ₂ CH ₂	3-Methoxy-3-propyl-2-oxetanyl
5	701	3-Methoxy-3-butyl-2-oxetanyl
702	CH ₂ CH ₂	3-Trimethylsilyloxy-3-methyl-2-oxetanyl
703	CH ₂ CH ₂	3-Trimethylsilyloxy-3-ethyl-2-oxetanyl
10	704	3-Trimethylsilyloxy-3-propyl-2-oxetanyl
705	CH ₂ CH ₂	3-Trimethylsilyloxy-3-butyl-2-oxetanyl
706	CH ₂ CH ₂	3-Oxetanyl
15	707	2-Furyl
708	CH ₂ CH ₂	4,5-Dihydro-2-furyl
709	CH ₂ CH ₂	2,3-Dihydro-2-furyl
710	CH ₂ CH ₂	3-Furyl
20	711	4,5-Dihydro-3-furyl
712	CH ₂ CH ₂	2,3-Dihydro-3-furyl
713	CH ₂ CH ₂	2-Thienyl
25	714	4,5-Dihydro-2-thienyl
715	CH ₂ CH ₂	2,3-Dihydro-2-thienyl
716	CH ₂ CH ₂	5-Chlor-2-thienyl
717	CH ₂ CH ₂	5-Methyl-2-thienyl
718	CH ₂ CH ₂	3-Thienyl
30	719	4,5-Dihydro-3-thienyl
720	CH ₂ CH ₂	2,3-Dihydro-3-thienyl
721	CH ₂ CH ₂	2-Pyrrolyl
722	CH ₂ CH ₂	2,5-Dihydro-2-pyrrolyl
35	723	3-Pyrrolyl
724	CH ₂ CH ₂	2,5-Dihydro-3-pyrrolyl
725	CH ₂ CH ₂	3-Isoxazolyl
726	CH ₂ CH ₂	4-Methyl-3-isoxazolyl
40	727	5-Methyl-3-isoxazolyl
728	CH ₂ CH ₂	4,5-Dimethyl-3-isoxazolyl
729	CH ₂ CH ₂	4,5-Dihydro-3-isoxazolyl
730	CH ₂ CH ₂	4-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
45	731	5-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
732	CH ₂ CH ₂	4,5-Dimethyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
733	CH ₂ CH ₂	4-Isoxazolyl

Nr.	X ^T	Het
5	734 CH ₂ CH ₂	3-Methyl-4-isoxazolyl
	735 CH ₂ CH ₂	5-Methyl-4-isoxazolyl
	736 CH ₂ CH ₂	5-Cyclopropyl-4-isoxazolyl
10	737 CH ₂ CH ₂	5-Phenyl-4-isoxazolyl
	738 CH ₂ CH ₂	3,5-Dimethyl-4-isoxazolyl
	739 CH ₂ CH ₂	4,5-Dihydro-4-isoxazolyl
	740 CH ₂ CH ₂	3-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
15	741 CH ₂ CH ₂	5-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
	742 CH ₂ CH ₂	3,5-Dimethyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
	743 CH ₂ CH ₂	5-Isoxazolyl
20	744 CH ₂ CH ₂	3-Methyl-5-isoxazolyl
	745 CH ₂ CH ₂	4-Methyl-5-isoxazolyl
	746 CH ₂ CH ₂	3,4-Dimethyl-5-isoxazolyl
25	747 CH ₂ CH ₂	4,5-Dihydro-5-isoxazolyl
	748 CH ₂ CH ₂	3-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
	749 CH ₂ CH ₂	4-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
30	750 CH ₂ CH ₂	3,4-Dimethyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
	751 CH ₂ CH ₂	3-Iothiazolyl
	752 CH ₂ CH ₂	4-Methyl-3-isothiazolyl
35	753 CH ₂ CH ₂	5-Methyl-3-isothiazolyl
	754 CH ₂ CH ₂	4-Iothiazolyl
	755 CH ₂ CH ₂	3-Methyl-4-isothiazolyl
40	756 CH ₂ CH ₂	5-Methyl-4-isothiazolyl
	757 CH ₂ CH ₂	5-Iothiazolyl
	758 CH ₂ CH ₂	3-Methyl-5-isothiazolyl
45	759 CH ₂ CH ₂	4-Methyl-5-isothiazolyl
	760 CH ₂ CH ₂	2-Oxazolyl
	761 CH ₂ CH ₂	4-Oxazolyl
50	762 CH ₂ CH ₂	5-Oxazolyl
	763 CH ₂ CH ₂	2-Thiazolyl
	764 CH ₂ CH ₂	4-Thiazolyl
55	765 CH ₂ CH ₂	5-Thiazolyl
	766 CH ₂ CH ₂	3-Pyrazolyl
	767 CH ₂ CH ₂	4-Pyrazolyl
60	768 CH ₂ CH ₂	1-Methyl-3-pyrazolyl

Nr.	X ^f	Het
769	CH ₂ CH ₂	1-Methyl-4-pyrazolyl
770	CH ₂ CH ₂	1-Methyl-5-pyrazolyl
5 771	CH ₂ CH ₂	2-Imidazolyl
772	CH ₂ CH ₂	1-Methyl-2-imidazolyl
773	CH ₂ CH ₂	5-Methyl-[1,3,4]-2-oxadiazolyl
10 774	CH ₂ CH ₂	5-Methyl-[1,2,4]-3-oxadiazolyl
775	CH ₂ CH ₂	5-Methyl-[1,3,4]-2-thiadiazolyl
776	CH ₂ CH ₂	5-Methyl-[1,2,4]-3-thiadiazolyl
777	CH ₂ CH ₂	[1,2,4]-3-triazolyl
15 778	CH ₂ CH ₂	[1,2,3]-4-triazolyl
779	CH ₂ CH ₂	2-Pyridyl
780	CH ₂ CH ₂	6-Chlor-2-pyridyl
781	CH ₂ CH ₂	6-Methoxy-2-pyridyl
20 782	CH ₂ CH ₂	6-Trifluormethyl-2-pyridyl
783	CH ₂ CH ₂	3-Pyridyl
784	CH ₂ CH ₂	2-Chlor-3-pyridyl
785	CH ₂ CH ₂	2-Methoxy-3-pyridyl
25 786	CH ₂ CH ₂	4-Pyridyl
787	CH ₂ CH ₂	2-Chlor-4-pyridyl
788	CH ₂ CH ₂	2-Methoxy-4-pyridyl
789	CH ₂ CH ₂	2-Ethoxy-4-pyridyl
30 790	CH ₂ CH ₂	2-Methylthio-4-pyridyl
791	CH ₂ CH ₂	2-Trifluormethyl-5-pyridyl
792	CH ₂ CH ₂	2-Pyrimidinyl
35 793	CH ₂ CH ₂	3-Pyrimidinyl
794	CH ₂ CH ₂	4-Pyrimidinyl
795	CH ₂ CH ₂	2-Pyrazinyl
796	CH ₂ CH ₂	3-Pyridazinyl
40 797	CH ₂ CH ₂	4-Pyridazinyl
798	CH ₂ CH ₂	2-(2H-1,3-oxazinyl)
799	CH ₂ CH ₂	2-(6H-1,3-oxazinyl)
800	CH ₂ CH ₂	4-(6H-1,3-oxazinyl)
45 801	CH ₂ CH ₂	6-(6H-1,3-oxazinyl)
802	CH ₂ CH ₂	[1,3,5]-2-Triazinyl
803	CH ₂ CH ₂	[1,2,4]-3-Triazinyl

Nr.	X ^[1]	Het
804	CH ₂ CH ₂	[1,2,4]-5-Triazinyl
805	CH ₂ CH ₂	[1,2,4]-6-Triazinyl
5 806	—C≡C—	Oxiranyl
807	—C≡C—	3-Methyl-2-oxiranyl
10 808	—C≡C—	2-Oxetanyl
809	—C≡C—	3-Hydroxy-3-methyl-2-oxetanyl
810	—C≡C—	3-Hydroxy-3-ethyl-2-oxetanyl
15 811	—C≡C—	3-Hydroxy-3-propyl-2-oxetanyl
812	—C≡C—	3-Hydroxy-3-butyl-2-oxetanyl
15 813	—C≡C—	3-Methoxy-3-methyl-2-oxetanyl
814	—C≡C—	3-Methoxy-3-ethyl-2-oxetanyl
15 815	—C≡C—	3-Methoxy-3-propyl-2-oxetanyl
20 816	—C≡C—	3-Methoxy-3-butyl-2-oxetanyl
20 817	—C≡C—	3-Trimethylsilyloxy-3-methyl-2-oxetanyl
818	—C≡C—	3-Trimethylsilyloxy-3-ethyl-2-oxetanyl
20 819	—C≡C—	3-Trimethylsilyloxy-3-propyl-2-oxetanyl
20 820	—C≡C—	3-Trimethylsilyloxy-3-butyl-2-oxetanyl
25 821	—C≡C—	3-Oxetanyl
822	—C≡C—	2-Furyl
25 823	—C≡C—	4,5-Dihydro-2-furyl
30 824	—C≡C—	2,3-Dihydro-2-furyl
30 825	—C≡C—	3-Furyl
30 826	—C≡C—	4,5-Dihydro-3-furyl
30 827	—C≡C—	2,3-Dihydro-3-furyl
35 828	—C≡C—	2-Thienyl
35 829	—C≡C—	4,5-Dihydro-2-thienyl
35 830	—C≡C—	2,3-Dihydro-2-thienyl
40 831	—C≡C—	5-Chlor-2-thienyl
40 832	—C≡C—	5-Methyl-2-thienyl
40 833	—C≡C—	3-Thienyl
40 834	—C≡C—	4,5-Dihydro-3-thienyl
40 835	—C≡C—	2,3-Dihydro-3-thienyl
45 836	—C≡C—	2-Pyrrolyl
45 837	—C≡C—	2,5-Dihydro-2-pyrrolyl
45 838	—C≡C—	3-Pyrrolyl

Nr.	X ¹	Het
839	—C≡C—	2,5-Dihydro-3-pyrrolyl
840	—C≡C—	3-Isoxazolyl
5 841	—C≡C—	4-Methyl-3-isoxazolyl
842	—C≡C—	5-Methyl-3-isoxazolyl
843	—C≡C—	4,5-Dimethyl-3-isoxazolyl
10 844	—C≡C—	4,5-Dihydro-3-isoxazolyl
845	—C≡C—	4-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
846	—C≡C—	5-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
847	—C≡C—	4,5-Dimethyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
15 848	—C≡C—	4-Isoxazolyl
849	—C≡C—	3-Methyl-4-isoxazolyl
850	—C≡C—	5-Methyl-4-isoxazolyl
851	—C≡C—	5-Cyclopropyl-4-isoxazolyl
20 852	—C≡C—	5-Phenyl-4-isoxazolyl
853	—C≡C—	3,5-Dimethyl-4-isoxazolyl
854	—C≡C—	4,5-Dihydro-4-isoxazolyl
855	—C≡C—	3-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
25 856	—C≡C—	5-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
857	—C≡C—	3,5-Dimethyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
858	—C≡C—	5-Isoxazolyl
859	—C≡C—	3-Methyl-5-isoxazolyl
30 860	—C≡C—	4-Methyl-5-isoxazolyl
861	—C≡C—	3,4-Dimethyl-5-isoxazolyl
862	—C≡C—	4,5-Dihydro-5-isoxazolyl
863	—C≡C—	3-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
35 864	—C≡C—	4-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
865	—C≡C—	3,4-Dimethyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
866	—C≡C—	3-Iothiazolyl
40 867	—C≡C—	4-Methyl-3-isothiazolyl
868	—C≡C—	5-Methyl-3-isothiazolyl
869	—C≡C—	4-Iothiazolyl
870	—C≡C—	3-Methyl-4-isothiazolyl
45 871	—C≡C—	5-Methyl-4-isothiazolyl
872	—C≡C—	5-Iothiazolyl
873	—C≡C—	3-Methyl-5-isothiazolyl

Nr.	X ¹	Het
874	—C≡C—	4-Methyl-5-isothiazolyl
875	—C≡C—	2-Oxazolyl
5 876	—C≡C—	4-Oxazolyl
877	—C≡C—	5-Oxazolyl
10 878	—C≡C—	2-Thiazolyl
879	—C≡C—	4-Thiazolyl
15 880	—C≡C—	5-Thiazolyl
881	—C≡C—	3-Pyrazolyl
882	—C≡C—	4-Pyrazolyl
15 883	—C≡C—	1-Methyl-3-pyrazolyl
884	—C≡C—	1-Methyl-4-pyrazolyl
15 885	—C≡C—	1-Methyl-5-pyrazolyl
20 886	—C≡C—	2-Imidazolyl
887	—C≡C—	1-Methyl-2-imidazolyl
20 888	—C≡C—	5-Methyl-[1,3,4]-2-oxadiazolyl
889	—C≡C—	5-Methyl-[1,2,4]-3-oxadiazolyl
25 890	—C≡C—	5-Methyl-[1,3,4]-2-thiadiazolyl
891	—C≡C—	5-Methyl-[1,2,4]-3-thiadiazolyl
25 892	—C≡C—	[1,2,4]-3-triazolyl
893	—C≡C—	[1,2,3]-4-triazolyl
30 894	—C≡C—	2-Pyridyl
895	—C≡C—	6-Chlor-2-pyridyl
30 896	—C≡C—	6-Methoxy-2-pyridyl
897	—C≡C—	6-Trifluormethyl-2-pyridyl
35 898	—C≡C—	3-Pyridyl
899	—C≡C—	2-Chlor-3-pyridyl
35 900	—C≡C—	2-Methoxy-3-pyridyl
901	—C≡C—	4-Pyridyl
40 902	—C≡C—	2-Chlor-4-pyridyl
903	—C≡C—	2-Methoxy-4-pyridyl
40 904	—C≡C—	2-Ethoxy-4-pyridyl
905	—C≡C—	2-Methylthio-4-pyridyl
45 906	—C≡C—	2-Trifluormethyl-5-pyridyl
907	—C≡C—	2-Pyrimidinyl
45 908	—C≡C—	3-Pyrimidinyl

Nr.	X ¹	Het
5	909	—C≡C—
	910	4-Pyrimidinyl
	911	2-Pyrazinyl
	912	3-Pyridazinyl
	913	4-Pyridazinyl
10	914	2-(2 <i>H</i> -1,3-oxazinyl)
	915	2-(6 <i>H</i> -1,3-oxazinyl)
	916	4-(6 <i>H</i> -1,3-oxazinyl)
	917	6-(6 <i>H</i> -1,3-oxazinyl)
	918	[1,3,5]-2-Triazinyl
15	919	[1,2,4]-3-Triazinyl
	920	[1,2,4]-5-Triazinyl
		[1,2,4]-6-Triazinyl

20

25

30

35

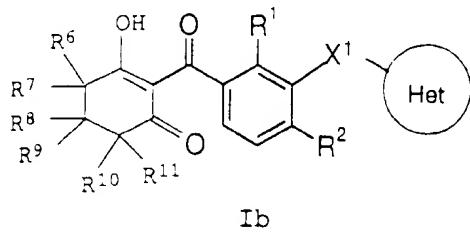
40

45

Die folgenden Tabellen 1 - 36 basieren auf den 2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dionen der Formel Ib

5

10



15

Tabelle 1: Verbindungen 1.1-1.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Chlor, R² Methylsulfonyl, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰ und R¹¹ Wasserstoff bedeutet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

20 Tabelle 2: Verbindungen 2.1-2.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ und R² Chlor, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰ und R¹¹ Wasserstoff bedeutet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

25

Tabelle 3: Verbindungen 3.1-3.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Chlor, R² Trifluormethyl, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰ und R¹¹ Wasserstoff bedeutet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

30

Tabelle 4: Verbindungen 4.1-4.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Methyl, R² Chlor, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰ und R¹¹ Wasserstoff bedeutet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

35

Tabelle 5: Verbindungen 5.1-5.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Methyl, R² Methylsulfonyl, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰ und R¹¹ Wasserstoff bedeutet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

40

Tabelle 6: Verbindungen 6.1-6.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Methyl, R² Trifluormethyl, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰ und R¹¹ Wasserstoff bedeutet und

54

die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 7: Verbindungen 7.1-7.920

5 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Chlor, R² Methylsulfonyl, R⁶, R⁷, R¹⁰ und R¹¹ Wasserstoff, R⁸ und R⁹ Methyl bedeutet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

10 Tabelle 8: Verbindungen 8.1-8.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ und R² Chlor, R⁶, R⁷, R¹⁰ und R¹¹ Wasserstoff, R⁸ und R⁹ Methyl bedeutet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

15

Tabelle 9: Verbindungen 9.1-9.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Chlor, R² Trifluormethyl, R⁶, R⁷, R¹⁰ und R¹¹ Wasserstoff, R⁸ und R⁹ Methyl bedeutet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

20

Tabelle 10: Verbindungen 10.1-10.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Methyl, R² Chlor, R⁶, R⁷, R¹⁰ und R¹¹ Wasserstoff, R⁸ und R⁹ Methyl bedeutet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 11: Verbindungen 11.1-11.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Methyl, R² Methylsulfonyl, R⁶, R⁷, R¹⁰ und R¹¹ Wasserstoff, R⁸ und R⁹ Methyl bedeutet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 12: Verbindungen 12.1-12.920

35 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Methyl, R² Trifluormethyl, R⁶, R⁷, R¹⁰ und R¹¹ Wasserstoff, R⁸ und R⁹ Methyl bedeutet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen..

40 Tabelle 13: Verbindungen 13.1-13.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Chlor, R² Methylsulfonyl, R⁶, R⁷, R⁸ und R⁹ Wasserstoff, R¹⁰ und R¹¹ Methyl bedeutet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

45

55

Tabelle 14: Verbindungen 14.1-14.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ und R² Chlor, R⁶, R⁷, R⁸ und R⁹ Wasserstoff, R¹⁰ und R¹¹ Methyl bedeutet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 15: Verbindungen 15.1-15.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Chlor, R² Trifluormethyl, R⁶, R⁷, R⁸ und R⁹ Wasserstoff, R¹⁰ und R¹¹ Methyl bedeutet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 16: Verbindungen 16.1-16.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Methyl, R² Chlor, R⁶, R⁷, R⁸ und R⁹ Wasserstoff, R¹⁰ und R¹¹ Methyl bedeutet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 17: Verbindungen 17.1-17.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Methyl, R² Methylsulfonyl, R⁶, R⁷, R⁸ und R⁹ Wasserstoff, R¹⁰ und R¹¹ Methyl bedeutet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

25 Tabelle 18: Verbindungen 18.1-18.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Methyl, R² Trifluormethyl, R⁶, R⁷, R⁸ und R⁹ Wasserstoff, R¹⁰ und R¹¹ Methyl bedeutet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

30

Tabelle 19: Verbindungen 19.1-19.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Chlor, R² Methylsulfonyl, R⁶, R⁷, R¹⁰ und R¹¹ Methyl bedeutet, die CR⁸R⁹-Einheit eine Gruppe C=O bildet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 20: Verbindungen 20.1-20.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ und R² Chlor, R⁶, R⁷, R¹⁰ und R¹¹ Methyl bedeutet, die CR⁸R⁹-Einheit eine Gruppe C=O bildet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 21: Verbindungen 21.1-21.920

45 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Chlor, R² Trifluormethyl, R⁶, R⁷, R¹⁰ und R¹¹ Methyl bedeutet, die CR⁸R⁹-Einheit eine Gruppe C=O bildet und die Substituenten X¹ und Het für jede

56

einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 22: Verbindungen 22.1-22.920

5 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Methyl, R² Chlor, R⁶, R⁷, R¹⁰ und R¹¹ Methyl bedeutet, die CR⁸R⁹-Einheit eine Gruppe C=O bildet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

10 Tabelle 23: Verbindungen 23.1-23.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Methyl, R² Methylsulfonyl, R⁶, R⁷, R¹⁰ und R¹¹ Methyl bedeutet, die CR⁸R⁹-Einheit eine Gruppe C=O bildet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-
15 sprechen.

Tabelle 24: Verbindungen 24.1-24.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Methyl, R² Tri-
20 fluormethyl, R⁶, R⁷, R¹⁰ und R¹¹ Methyl bedeutet, die CR⁸R⁹-Einheit eine Gruppe C=O bildet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspre-
chen.

Tabelle 25: Verbindungen 25.1-25.920

25 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Methylsulfonyl, R⁶, R⁷, R⁸, R¹⁰ und R¹¹ Wasserstoff, R⁹ Methyl bedeutet, die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

30 Tabelle 26: Verbindungen 26.1-26.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ und R² Chlor, R⁶, R⁷, R⁸, R¹⁰ und R¹¹ Wasserstoff, R⁹ Methyl bedeutet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

35

Tabelle 27: Verbindungen 27.1-27.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Chlor, R² Tri-
fluormethyl, R⁶, R⁷, R⁸, R¹⁰ und R¹¹ Wasserstoff, R⁹ Methyl bedeu-
tet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung
40 jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 28: Verbindungen 28.1-28.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Methyl, R²
Chlor, R⁶, R⁷, R⁸, R¹⁰ und R¹¹ Wasserstoff, R⁹ Methyl bedeutet und
45 die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 29: Verbindungen 29.1-29.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Methyl, R² Methylsulfonyl, R⁶, R⁷, R⁸, R¹⁰ und R¹¹ Wasserstoff, R⁹ Methyl bedeutet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 30: Verbindungen 30.1-30.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Methyl, R² Trifluormethyl, R⁶, R⁷, R⁸, R¹⁰ und R¹¹ Wasserstoff, R⁹ Methyl bedeutet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 31: Verbindungen 31.1-31.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Chlor, R² 15 Methylsulfonyl, R⁶, R⁷, R⁹ und R¹⁰ Wasserstoff bedeutet, R⁸ und R¹¹ zusammen eine Methylengruppe bilden und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

20 Tabelle 32: Verbindungen 32.1-32.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ und R² Chlor, R⁶, R⁷, R⁹ und R¹⁰ Wasserstoff bedeutet, R⁸ und R¹¹ zusammen eine 25 Methylengruppe bilden und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 33: Verbindungen 33.1-33.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Chlor, R² Tri-30 fluormethyl, R⁶, R⁷, R⁹ und R¹⁰ Wasserstoff bedeutet, R⁸ und R¹¹ zusammen eine Methylengruppe bilden und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 34: Verbindungen 34.1-34.920

35 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Methyl, R² Chlor, R⁶, R⁷, R⁹ und R¹⁰ Wasserstoff bedeutet, R⁸ und R¹¹ zusammen eine Methylengruppe bilden und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

40

Tabelle 35: Verbindungen 35.1-35.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Methyl, R² 45 Methylsulfonyl, R⁶, R⁷, R⁹ und R¹⁰ Wasserstoff bedeutet, R⁸ und R¹¹ zusammen eine Methylengruppe bilden und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 36: Verbindungen 36.1-36.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Methyl, R² Tri-fluormethyl, R⁶, R⁷, R⁹ und R¹⁰ Wasserstoff bedeutet, R⁸ und R¹¹ zusammen eine Methylengruppe bilden und die Substituenten X¹ und 5 Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Die Verbindungen I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze eignen sich - sowohl als Isomerengemische als auch in Form der 10 reinen Isomeren - als Herbizide. Die I enthaltenden herbiziden Mittel bekämpfen Pflanzenwuchs auf Nichtkulturflächen sehr gut, besonders bei hohen Aufwandmengen. In Kulturen wie Weizen, Reis, Mais, Soja und Baumwolle wirken sie gegen Unkräuter und Schadgräser, ohne die Kulturpflanzen nennenswert zu schädigen. Dieser 15 Effekt tritt vor allem bei niedrigen Aufwandmengen auf.

In Abhängigkeit von der jeweiligen Applikationsmethode können die Verbindungen I bzw. sie enthaltende Mittel noch in einer weiteren Zahl von Kulturpflanzen zur Beseitigung unerwünschter Pflanzen 20 eingesetzt werden. In Betracht kommen beispielsweise folgende Kulturen:

Allium cepa, Ananas comosus, Arachis hypogaea, Asparagus officinalis, Beta vulgaris spec. altissima, Beta vulgaris spec. 25 rapa, Brassica napus var. napus, Brassica napus var. napobrassica, Brassica rapa var. silvestris, Camellia sinensis, Carthamus tinctorius, Carya illinoinensis, Citrus limon, Citrus sinensis, Coffea arabica (Coffea canephora, Coffea liberica), Cucumis sativus, Cynodon dactylon, Daucus carota, Elaeis 30 guineensis, Fragaria vesca, Glycine max, Gossypium hirsutum, (Gossypium arboreum, Gossypium herbaceum, Gossypium vitifolium), Helianthus annuus, Hevea brasiliensis, Hordeum vulgare, Humulus lupulus, Ipomoea batatas, Juglans regia, Lens culinaris, Linum usitatissimum, Lycopersicon lycopersicum, Malus spec., Manihot 35 esculenta, Medicago sativa, Musa spec., Nicotiana tabacum (N. rustica), Olea europaea, Oryza sativa, Phaseolus lunatus, Phaseolus vulgaris, Picea abies, Pinus spec., Pisum sativum, Prunus avium, Prunus persica, Pyrus communis, Ribes sylvestre, Ricinus communis, Saccharum officinarum, Secale cereale, Solanum 40 tuberosum, Sorghum bicolor (s. vulgare), Theobroma cacao, Trifolium pratense, Triticum aestivum, Triticum durum, Vicia faba, Vitis vinifera, Zea mays.

Darüber hinaus können die Verbindungen I auch in Kulturen, die 45 durch Züchtung einschließlich gentechnischer Methoden gegen die Wirkung von Herbiziden tolerant sind, verwandt werden.

Die Applikation der herbiziden Mittel bzw. der Wirkstoffe kann im Vorauflauf- oder im Nachauflaufverfahren erfolgen. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei welchen die 5 herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, daß die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post directed, lay-by).

10 Die Verbindungen I bzw. die sie enthaltenden herbiziden Mittel können beispielsweise in Form von direkt versprühbaren wäßrigen Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wäßrigen, öligen oder sonstigen Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, 15 Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln oder Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfundungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

20 Als inerte Zusatzstoffe kommen im wesentlichen in Betracht: Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, alkylierte Benzole oder 25 deren Derivate, Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Ketone wie Cyclohexanon oder stark polare Lösungsmittel, z.B. Amine wie N-Methylpyrrolidon oder Wasser.

30 Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Suspensionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die 35 substituierte 2-Benzoylcyclohexan-1,3-dione als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder 40 Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen die Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B. Lignin-, 45 Phenol-, Naphthalin- und Dibutynaphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta-

und Octadecanolen sowie von Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner Derivate mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxy-
5 ethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder Nonylphenol, Alkylphenyl-, Tributylphenylpolyglykolether, Alkyl-arylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether oder Polyoxypropylenealkylether, Laurylalkoholpolyglykolether-
10 acetat, Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder Methylcellulose in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen
15 Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Kiesel-
20 säuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte wie Getreidemehl, Baumrinden-,
25 Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe.

Die Konzentration der Wirkstoffe I in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in weiten Bereichen variiert werden. Die Formulierungen enthalten im allgemeinen 0,001 bis 98 Gew.-%, vorzugsweise 0,01 bis 95 Gew.-%, mindestens eines Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90 % bis 100 %, vorzugsweise 95 % bis 100 % (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.
30

35 Die erfindungsgemäßen Verbindungen I können beispielsweise wie folgt formuliert werden:

I 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 20.39 werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen alkyliertem Benzol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000
40
45

61

Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

- II 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 20.39 werden in einer
5 Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon,
30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anla-
gerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctyl-
phenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von
10 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Ein-
gießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Ge-
wichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion,
die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- III 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 20.39 werden in einer
15 Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon,
65 Gewichtsteilen einer Mineralölfaktion vom Siedepunkt
210 bis 280°C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungspro-
duktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht.
Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in
20 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige
Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- IV 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 20.39 werden mit
25 3 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-
naphthalinsulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natrium-
salzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge
und 60 Gewichtsteilen pulverförmigen Kieselsäuregel gut
vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch fei-
nes Verteilen der Mischung in 20 000 Gewichtsteilen Was-
30 ser enthält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des
Wirkstoffs enthält.
- V 3 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 20.39 werden mit
35 97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin vermischt. Man er-
hält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.-% des
Wirkstoffs enthält.
- VI 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 20.39 werden mit
40 3 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfon-
säure, 8 Gewichtsteilen Fettalkohol-polyglykolether,
2 Gewichtsteilen Natriumsalz eines Phenol-Harnstoff-For-
maldehyd-Kondensates und 68 Gewichtsteilen eines paraffi-
nischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine sta-
bile ölige Dispersion.

VII 1 Gewichtsteil der Verbindung Nr. 20.39 wird in einer Mischung gelöst, die aus 70 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 20 Gewichtsteilen ethoxyliertem Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen ethoxyliertem Ricinusöl besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.

VIII 1 Gewichtsteil der Verbindung Nr. 20.39 wird in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Cyclohexanon und 20 Gewichtsteilen Wettol ® EM 31 (nicht ionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Ricinusöl). Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.

Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die substituierte 2-Benzoylcyclohexan-1,3-dione mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstumsregulierender Wirkstoffgruppen gemischt und gemeinsam ausgebracht werden. Beispielsweise kommen als Mischungspartner 1,2,4-Thiadiazole, 1,3,4-Thiadiazole, Amide, Aminophosphorsäure und deren Derivate, Aminotriazole, Anilide, (Het)-Aryloxyalkansäure und deren Derivate, Benzoesäure und deren Derivate, Benzo-thiadiazone, 2-Aroyl-1,3-cyclohexandione, Hetaryl-Aryl-Ketone, Benzylisooxazolidinone, Meta-CF₃-phenylderivate, Carbamate, Chinolincarbonsäure und deren Derivate, Chloracetanilide, Cyclohexan-1,3-dionederivate, Diazine, Dichlorpropionsäure und deren Derivate, Dihydrobenzofurane, Dihydrofuran-3-one, Dinitroaniline, Dinitrophenole, Diphenylether, Dipyridyle, Halogencarbonsäuren und deren Derivate, Harnstoffe, 3-Phenyluracile, Imidazole, Imidazolinone, N-Phenyl-3,4,5,6-tetrahydropthalimide, Oxadiazole, Oxirane, Phenole, Aryloxy- oder Heteroaryloxyphenoxy-propionsäureester, Phenylessigsäure und deren Derivate, Phenylpropionsäure und deren Derivate, Pyrazole, Phenylpyrazole, Pyridazine, Pyridincarbonsäure und deren Derivate, Pyrimidyl-ether, Sulfonamide, Sulfonylharnstoffe, Triazine, Triazinone, Triazolinone, Triazolcarboxamide, Uracile in Betracht.

Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen I allein oder in Kombination mit anderen herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt, gemeinsam auszubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

Die Aufwandmengen an Wirkstoff betragen je nach Bekämpfungsziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0,001 bis 3,0, vorzugsweise 0,01 bis 1,0 kg/ha aktive Substanz (a.S.).

5 Nachfolgend werden die Synthesen einiger Edukte und Produkte beschrieben.

2-Chlor-3-((4,5-dihydro-3-isoxazolylmethyl)-phenyl)-4-sulfonylmethyl-(5,5-dimethyl-cyclohexan-1,3-dion)-methanon

10

Stufe a: 2-Chlor-3-(2-nitroethenyl)-4-sulfonylmethyl-benzoësäure-methylester

15 50 g (0,18 mol) 2-Chlor-3-formyl-4-sulfonylmethyl-benzoësäure-methylester, 220 g (3,6 mol) Nitromethan, 216 g (3,6 mol) Eisesig und 7 g (91 mmol) Ammoniumacetat werden unter Ausschluß von Luftfeuchtigkeit bei 85°C gerührt. Das Reaktionsgemisch wird auf 2 l dest. Wasser gegossen und mit Diethylether extrahiert. Die organische Phase wird mit gesättigter, wäßriger Natriumhydrogen-carbonat-Lösung gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet, filtriert und i. Vak. vom Lösungsmittel befreit. Das Rohprodukt wird aus n-Hexan/Essigsäureethylester umkristallisiert. Ausbeute: 13,1 g, Fp. 147 - 150°C

25 Stufe b: 2-Chlor-3-(2-nitroethyl)-4-sulfonylmethyl-benzoësäure-methylester

30 19,4 g (61 mmol) 2-Chlor-3-(2-nitroethenyl)-4-sulfonylmethyl-benzoësäuremethylester und 121 g Kieselgel 60 werden in 180 ml 2-Propanol und 970 ml Chloroform suspendiert und bei Raumtemp. mit 3,5 g (94 mmol) Natriumborhydrid behandelt. Das Reaktionsgemisch wird filtriert, das Filtrat mit Dichlormethan/ Methanol 1:1 (v/v) gewaschen und die organische Phase i. Vak. vom Lösungsmittel befreit. Ausbeute: 19,5 g; ¹H-NMR, δ [ppm], CDCl₃: 3,2 (s), 35 3,9 (m), 4,0 (s), 4,7 (m), 7,8 (d), 8,1 (d)

Stufe c: 2-Chlor-3-((4,5-dihydro-3-isoxazolylmethyl)-4-sulfonylmethyl-benzoësäuremethylester

40 Eine Lösung aus 2,8 g (23 mmol) Phenylisocyanat in 50 ml Toluol wird bei Raumtemp. mit Ethylen begast. Dazu wird eine Lösung aus 3,7 g (11 mmol) 2-Chlor-3-(2-nitroethyl)-4-sulfonylmethyl-benzoësäuremethylester und 0,5 ml Triethylamin in 100 ml Toluol gegeben. Das Reaktionsgemisch wird in 300 ml Diethylether aufgenommen, mit dest. Wasser extrahiert, mit Natriumsulfat getrocknet, filtriert und i. Vak vom Lösungsmittel befreit. Das Rohprodukt wird an Kieselgel 60 mit Cyclohexan/Essigsäureethylester gerei-

nigt. Ausbeute: 1.0 g; $^1\text{H-NMR}$, δ [ppm], CDCl_3 : 3,1 (t), 3,2 (s), 4,0 (s), 4,4 (t), 4,5 (s), 7,7 (d), 8,1 (d)

Stufe d: 2-Chlor-3-((4,5-dihydro-3-isoxazolylmethyl)-4-sulfonyl-methyl-benzoësäure
5

Eine Lösung aus 2,3 g (7 mmol) 2-Chlor-3-((4,5-dihydro-3-isoxazolylmethyl)-4-sulfonylmethyl-benzoësäuremethylester in 40 ml Tetrahydrofuran wird bei 5°C mit 0,3 g (13 mmol) Lithiumhydroxid 10 behandelt. Das Reaktionsgemisch wird in 300 ml Diethylether aufgenommen und mit 10 %iger, wässriger Salzsäure-Lösung auf pH 1 eingestellt. Die wässrige Phase wird mit Diethylether extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und i. Vak. vom Lösungsmittel befreit.

15 Ausbeute 1,7 g; $^1\text{H-NMR}$, δ [ppm], DMSO-d_6 : 3,0 (t), 3,3 (s), 4,2 (t), 4,3 (s), 7,8 (d), 8,1 (d)

Stufe e: 2-Chlor-3-((4,5-dihydro-3-isoxazolylmethyl)-phenyl)-4-sulfonylmethyl-(5,5-dimethyl-cyclohexan-1,3-dion)-methanon (Tabelle 7, Beispiel 39)
20

Eine Lösung aus 1,0 g (3 mmol) 2-Chlor-3-((4,5-dihydro-3-isoxazolylmethyl)-4-sulfonylmethyl-benzoësäure und 440 mg (3 mmol) Dimedon in 50 ml Acetonitril wird bei 40°C mit 0,8 g (3.8 mmol) 25 N,N -Dicyclohexylcarbodiimid behandelt. Nach abgeschlossener Reaktion (DC-Kontrolle) gibt man 310 mg (3 mmol) Trimethylsilylcyanid und 950 mg (9 mmol) Triethylamin zu. Das Reaktionsgemisch wird filtriert und i. Vak. vom Lösungsmittel befreit. Das Rohprodukt wird an Kieselgel 30 mit Toluol/ Tetrahydrofuran oder Dichlormethan/Toluol gereinigt. Ausbeute 600 mg; Fp. 168 - 173°C

Die im folgenden beschriebenen Verbindungen wurden analog zu den oben angegebenen Arbeitsvorschriften dargestellt.

35 2-Chlor-3-((4,5-dihydro-3-isoxazolylmethyl)-phenyl)-4-sulfonyl-methyl-(cyclohexan-1,3-dion)-methanon (Tabelle 1, Beispiel 39)
Fp. 70 - 74°C

2-Chlor-3-((4,5-dihydro-3-isoxazolylmethyl)-phenyl)-4-sulfonyl-methyl-(3,3,6,6-tetramethyl-cyclohexan-1,3,5-trion)-methanon
40 (Tabelle 19, Beispiel 39)
Fp. 168 - 173°C

2,4-Dichlor-3-((4,5-dihydro-3-isoxazolylmethyl)-phenyl)-(5,5-di-
45 methyl-cyclohexan-1,3-dion)-methanon (Tabelle 8, Beispiel 39)
Fp. 56 - 64°C

65

2,4-Dichlor-3-((4,5-dihydro-3-isoxazolylme-thyl)-phenyl)-(3,3,6,6-tetramethyl-cyclohexan-1,3,5-trion)-methanon (Tabelle 20, Beispiel 39)

Fp. 196 - 202°C

5

2,4-Dichlor-3-((3-(5H-furanon)methyl)phenyl)-2,2,4,4,-tetra-methyl-1,3,5-cyclohexantrion)methanon

Stufe a: 2,4-Dichlor-3-(3-(5H-furanon)methyl)benzoësäure

10 Die Lösung von 13 g (0,038 mol)

2,4-Dichlor-3-(3-furyl)hydroxymethylbenzoësäure-tert-butylester und 1,8 g p-Toluolsulfonsäure in 370 ml Toluol werden 6h refluxiert. Anschließend wird auf 100 ml 10 % Natronlauge gegeben und mit Essigester extrahiert. Die wässrige Phase wird mit Salzsäure angesäuert und mit Essigester mehrmals extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden mit Wasser gewaschen, getrocknet und eingeengt. Es verbleiben 4,8 g (45 %) der Titelverbindung Fp. 196°C

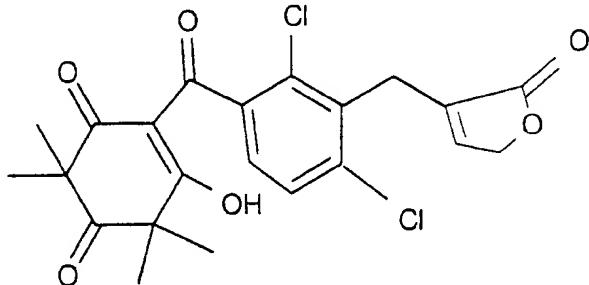
15

Stufe b: 2,4-Dichlor-3-((3-(5H-furanon)methyl)phenyl)-(2,2,4,4-te-tramethyl-1,3,5-cyclohexantrion)methanon

20

25

30



35

1,6 g (0,0056 mol) der so erhaltenen Säure, 1,0 g (0,0056 mol) 2,2,4,4-tetramethyl-1,3,5-cyclohexantrion und 1,15 g (0,0056 mol) Dicyclohexylcarbodiimid werden bei Raumtemperatur in 15 ml Acetonitril gerührt. Anschließend werden 1,13 g (0,012 mol) Triethylamin und 0,1 ml Trimethylsilylycyanid zugegeben und weitere 12h bei Raumtemperatur belassen.

40

Der Reaktionsansatz wird mit 50 ml Essigester verdünnt, mit 50 ml Natriumcarbonat-Lösung versetzt und der entstandene Niederschlag verworfen. Die organische Phase wird abgetrennt, getrocknet und eingeengt. Der erhaltene

45

66

Rückstand wird an einer Kieselgelsäule chromatographiert (Cyclohexan/Essigester 1:10). Man erhält 120 mg (5 %) der Titelverbindung.

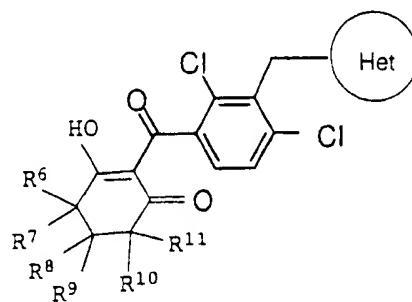
(charakteristische ^{13}C -NMR-Daten: 209.1, 197.6, 195.9,
5 195.1, 173.4, 145.6, 137.7, 136.2, 134.7, 131.3, 130.6,
128.6, 126.2, 110.2, 70.5, 27.7,

In analoger Weise wurde hergestellt:
10 2,4-Dichlor-3-((3-(5H-furanon)methyl)phenyl)-(1,3-cyclohexandion-2yl)methanon
Schmelzpunkt: 119-121

Tabelle 37

15

20



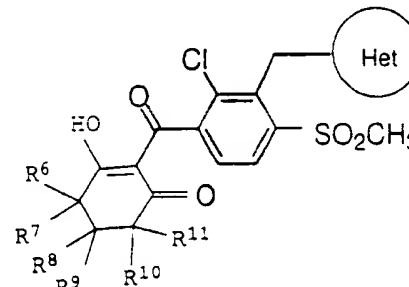
25

Nr.	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	Het	Fp. [°C]	^1H - NMR [ppm]
37.1	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4,5-Dihydro-3-isoxazolyl	64	
37.2	CH ₃	CH ₃		C=O	CH ₃	CH ₃	4,5-Dihydro-3-isoxazolyl	202	

Tabelle 38

35

40



45

Nr.	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	Het	Fp. [°C]	¹ H-NMR [ppm]
5	38.1	H	H	H	H	H	4,5-Dihydro-3-isoxazolyl	74	
	38.2	H	H	CH ₃	CH ₃	H	4,5-Dihydro-3-isoxazolyl	96	
	38.3	H	H	CH ₃	CH ₃	H	4,5-Dihydro-5-methyl-3-isoxazolyl	119	
10	38.4	H	H	CH ₃	CH ₃	H	3-Isoxazolyl	92	
	38.5	CH ₃	CH ₃	C=O	CH ₃	CH ₃	4,5-Dihydro-3-isoxazolyl	173	
15	38.6	CH ₃	CH ₃	C=O	CH ₃	CH ₃	4,5-Dihydro-5-chlor-methyl-3-isoxazolyl	84	

Anwendungsbeispiele

Die herbizide Wirkung der substituierte 2-Benzoylcyclohexan-1,3-dione der Formel I ließ sich durch Gewächshausversuche zeigen:

Als Kulturgefäße dienten Plastiktöpfe mit lehmigem Sand mit etwa 3,0% Humus als Substrat. Die Samen der Testpflanzen wurden nach 25 Arten getrennt eingesät.

Bei Vorauflaufbehandlung wurden die in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffe direkt nach Einsaat mittels fein verteilender Düsen aufgebracht. Die Gefäße wurden leicht beregnet, um 30 Keimung und Wachstum zu fördern, und anschließend mit durchsichtigen Plastikhauben abgedeckt, bis die Pflanzen angewachsen waren. Diese Abdeckung bewirkt ein gleichmäßiges Keimen der Testpflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt wurde.

Zum Zweck der Nachauflaufbehandlung wurden die Testpflanzen je nach Wuchsform erst bis zu einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm angezogen und dann mit den in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffen behandelt. Die Testpflanzen wurden dafür entweder direkt gesät und in den gleichen Gefäßen aufgezogen oder sie wurden erst als Keimpflanzen getrennt angezogen und einige Tage vor der Behandlung in die Versuchsgefäße verpflanzt. Die Aufwandmenge für die Nachauflaufbehandlung betrug 0.5 bzw. 0.25 kg/ha a. S.

45 Die Pflanzen wurden artenspezifisch bei Temperaturen von 10 - 25°C bzw. 20 - 35°C gehalten. Die Versuchsperiode erstreckte sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit wurden die Pflanzen gepflegt,

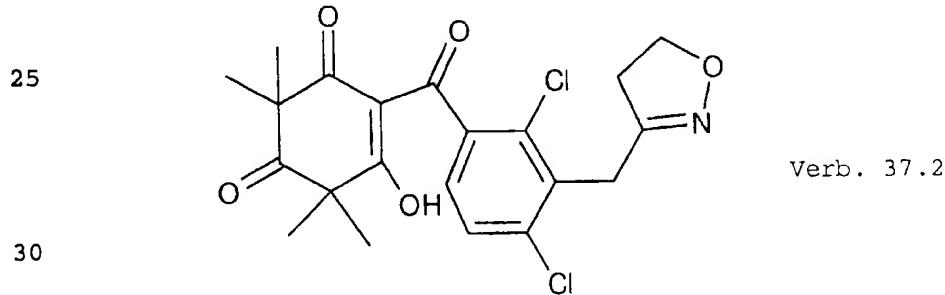
und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wurde ausgewertet.

Bewertet wurde nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100
 5 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler Wachstumsverlauf.

Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzten sich
 10 aus folgenden Arten zusammen:

<u>Lateinischer Name</u>	<u>Deutscher Name</u>	<u>Englischer Name</u>
Chenopodium album	Weißer Gänsefuß	lambsquarters (goosefoot)
15 Setaria viridis	Grüne Borstenhirse	green foxtail
Sinapis alba	Weißer Senf	white mustard
Solanum nigrum	Schwarzer Nachtschatten	black nightshade
20		

Herbizide Aktivität bei Nachauflaufanwendung im Gewächshaus

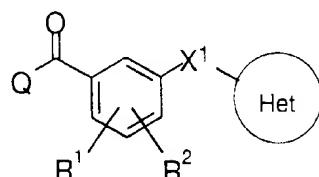


Oben genannte Unkräuter werden von der Verbindung 37.2 im Nachauflauf bei Aufwandmengen von 0,5 bzw. 0,25 kg/ha a.S. sehr gut
 35 bekämpft.

Patentansprüche

5 1. 2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dione der Formel I

10



I

15 in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

- 20 R¹, R² Wasserstoff, Mercapto, Nitro, Halogen, Cyano,
 Rhodano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl,
 C₁-C₆-Alkoxy, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, -OR³,
 -OCOR³, -OSO₂R³, -S(O)_nR³, -SO₂OR³, -SO₂N(R³)₂,
 -NR³SO₂R³ oder -NR³COR³;
- 25 R³ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl,
 C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, Phenyl oder Phe-
 nyl-C₁-C₆-alkyl; wobei die genannten Alkylreste par-
 tiell oder vollständig halogeniert sein können und/
 oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kön-
 nen:
- 30 Hydroxy, Mercapto, Amino, Cyano, R³, -OR³, -SR³,
 -N(R³)₂, =NOR³, -OCOR³, -SCOR³, -NR³COR³, -CO₂R³,
 -COSR³, -CON(R³)₂, C₁-C₄-Alkyliminoxy, C₁-C₄-Alkoxy-
 amino, C₁-C₄-Alkylicarbonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₆-alkoxy-
 carbonyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Heterocyclyl, Hetero-
 cycloxy, Phenyl, Benzyl, Hetaryl, Phenoxy, Benzyl-
 oxy und Hetarylxy, wobei die acht letztgenannten Re-
 ste ihrerseits substituiert sein können;
- 35 n 0, 1 oder 2;
- 40 Q ein gegebenenfalls substituierter, in 2-Stellung ver-
 knüpfter Cyclohexan-1,3-dion-Ring;
- 45 X¹ eine geradkettige oder verzweigte C₁-C₆-Alkylen-,
 eine C₂-C₆-Alkenylen- oder eine C₂-C₆-Alkinylenkette,
 wobei die genannten Alkylen-, Alkenylen- oder Alkiny-

70

lenreste partiell halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:

-OR⁴, -OCOR⁴, -OCONHR⁴ oder -OSO₂R⁴

5

und wobei die genannten Alkenylenreste ausgenommen sind, bei denen sich die Doppelbindung in α, β -Position zum Phenylring befindet und bei denen Het über die β -Position an die Doppelbindung gebunden ist;

10

15

R⁴ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, wobei die genannten Alkyl-, Alkenyl oder Alkinylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/ oder durch einen oder mehrere der folgenden Reste substituiert sein können:

20

Hydroxy, Mercapto, Amino, Cyano, Nitro, Formyl, C₁-C₄-Alkylamino, C₁-C₄-Dialkylamino, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl-oxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy;

25

Het eine drei- bis sechsgliedrige, teilweise oder vollständig gesättigte, heterocyclische Gruppe oder eine drei- bis sechsgliedrige heteroaromatische Gruppe mit bis zu drei Heteroatomen ausgewählt aus der Gruppe:

30

Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel,

35

wobei die gennante heterocyclische oder heteroaromatiche Gruppe partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder durch R⁵ substituiert sein kann;

40

45

R⁵ Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Amino, Cyano, Nitro, Formyl, C₁-C₄-Alkylamino, C₁-C₄-Dialkylamino, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, wobei die Alkylreste in allen Fällen jeweils durch einen oder mehrere der folgenden Reste substituiert sein können:

71

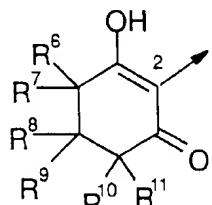
Cyano, Formyl, C₁-C₄-Alkylamino, C₁-C₄-Dialkylamino,
 C₁-C₄-Alkoxy carbonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl,
 C₁-C₄-Alkylcarbonyloxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogen-
 alkyl, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio,
 C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy;

5

sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.

- 10 2. 2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dione der Formel I nach Anspruch 1,
 in der Q ein in 2-Stellung verknüpfter Cyclohexan-1,3-dion-
 Ring der Formel II

15



20

II

ist, wobei R⁶, R⁷, R⁹ und R¹¹ für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl
 stehen;

25

R⁸ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₃-C₄-Cycloalkyl
 steht, wobei die beiden letztgenannten Gruppen einen
 bis drei der folgenden Substituenten tragen können:

30

Halogen, C₁-C₄-Alkylthio oder C₁-C₄-Alkoxy;

oder

35

für Tetrahydropyran-2-yl, Tetrahydropyran-3-yl,
 Tetrahydropyran-4-yl, Tetrahydrothiopyran-2-yl,
 Tetrahydrothiopyran-3-yl, Tetrahydrothiopyran-4-yl,
 1,3-Dioxolan-2-yl, 1,3-Dioxan-2-yl, 1,3-Oxa-
 thiolan-2-yl, 1,3-Oxathian-2-yl, 1,3-Dithiolan-2-yl
 40 oder 1,3-Dithian-2-yl steht, wobei die 6 letztgenann-
 ten Reste durch einen bis drei C₁-C₄-Alkylreste sub-
 stituiert sein können;

45

R¹⁰ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy-
 carbonyl steht;

oder

R⁸ und R¹¹ gemeinsam eine p-Bindung oder einen drei- bis sechsgliedrigen carbocyclischen Ring bilden;

5

oder

die CR⁸R⁹-Einheit durch C=O ersetzt sein kann.

10

3. 2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dione der Formel I nach Anspruch 1 oder 2, in der

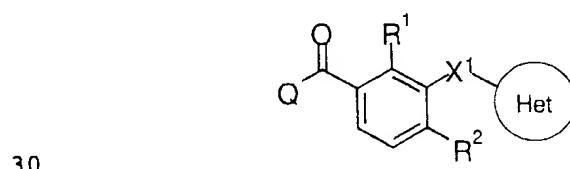
15

R¹ Nitro, Halogen, Cyano, Rhodano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, -OR³ oder -S(O)_nR³ bedeutet;

20

R² für Wasserstoff oder einen wie voranstehend unter R¹ genannten Rest steht.

25



Ia

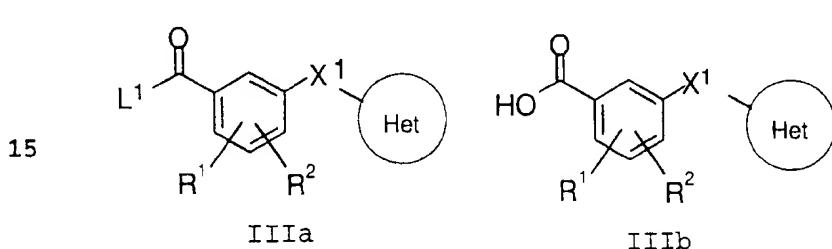
in der die Substituenten R¹, R², Q, X¹ und Het die unter Anspruch 1 genannte Bedeutung haben.

- 35
5. 2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dione der Formel Ia nach Anspruch 4, in der X¹ für eine C₁-C₂-Alkylen oder C₂-Alkinylene Kette steht.
- 40
6. 2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dione der Formel Ia nach einem der Ansprüche 1 bis 5, in der Het eine fünf- oder sechsgliedrige, teilweise oder vollständig gesättigte heterocyclische oder eine fünf- oder sechsgliedrige heteroaromatische Gruppe mit bis zu drei Heteroatomen ausgewählt aus der Gruppe
- 45

Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel

steht.

- 5 7. Verfahren zur Herstellung von 2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dionen
der Formel I gemäß den Ansprüchen 1 bis 6, dadurch gekenn-
zeichnet, daß man ein gegebenenfalls substituiertes Cyclo-
hexan-1,3-dion Q mit einer aktivierten Carbonsäure IIIa oder
mit einer Carbonsäure IIIb,
10



- 20 wobei die Substituenten R¹, R², X¹ und Het die in Anspruch 1
genannte Bedeutung haben und L¹ für eine nucleophil austauschbare Abgangsgruppe steht, acyliert und das Acylierungs-
produkt gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators zu
den Verbindungen I umlagert.
25

8. Aktivierte Carbonsäuren der Formel IIIa und Carbonsäuren der
Formel IIIb gemäß Anspruch 7, wobei die Substituenten R¹, R²,
X¹ und Het die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben und L¹
30 für eine nucleophil austauschbare Abgangsgruppe steht.

9. Mittel, enthaltend eine herbizid wirksame Menge mindestens
eines 2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dions der Formel I oder eines
35 landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß den Ansprü-
chen 1 bis 6 und für die Formulierung von Pflanzenschutzmit-
teln übliche Hilfsmittel.

10. Verfahren zur Herstellung von herbizid wirksamen Mitteln ge-
40 mäß Anspruch 9, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid-
wirksame Menge mindestens eines 2-Benzoyl-cyclo-
hexan-1,3-dions der Formel I oder eines landwirtschaftlich
brauchbaren Salzes von I gemäß den Ansprüchen 1 bis 6 und für
die Formulierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfs-
mittel mischt.
45

74

11. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs, da-
durch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge
mindestens eines 2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dions der Formel I
oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß
5 den Ansprüchen 1 bis 6 auf Pflanzen, deren Lebensraum und/
oder auf Samen einwirken läßt.
12. Verwendung der 2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dione der Formel I
und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze gemäß den An-
sprüchen 1 bis 6 als Herbizide.
10

15

20

25

30

35

40

45

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP 98/04636

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 6 C07D261/04 C07D307/58 A01N43/80 A01N43/08

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
IPC 6 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No
Y	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 96, no. 5, 31 May 1996 & JP 08 020554 A (HOKKO CHEM IND CO LTD), 23 January 1996 see abstract ----	1-4, 9, 12
Y	EP 0 320 864 A (SCHERING AG) 21 June 1989 cited in the application see claims 1,3,4 ----	1-4, 9, 12
A	EP 0 186 120 A (STAUFFER CHEMICAL CO.) 2 July 1986 see claims 1,21,23,37 ----	1-4, 7, 9-12
A	EP 0 186 119 A (STAUFFER CHEMICAL CO.) 2 July 1986 see claims 1,16,17,19 ----	1-4, 7, 9-12
		-/-

Further documents are listed in the continuation of box C

Patent family members are listed in annex

* Special categories of cited documents

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date.
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- "X" document of particular relevance, the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- "Y" document of particular relevance, the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
- "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

30 November 1998

Date of mailing of the international search report

15/12/1998

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office P B 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel (+31-70) 340-2040, Tx 31 651 epo nl
Fax (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Hass, C

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP 98/04636

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP 0 186 118 A (STAUFFER CHEMICAL CO.) 2 July 1986 see claims 1,27,28,45 ---	1-4,7, 9-12
A	EP 0 278 742 A (MAY & BAKER LTD) 17 August 1988 cited in the application see claims 1,5-7 ---	1-4,7, 9-12
A	US 4 780 127 A (W. J. MICHAELY ET AL.) 25 October 1988 see claims 1,20,38 ---	1-4,9-12
A	US 4 954 165 A (M. BABA ET AL.) 4 September 1990 see claims 1,4,5; tables ---	1-4,9-12
A	EP 0 317 158 A (ICI AMERICAS INC) 24 May 1989 see claims 1,5,6 ---	1-4,9-12
A	WO 91 00260 A (NIPPON SODA CO., LTD.) 10 January 1991 see claims 1,3; table 1 ---	1-4,9,12

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 98/04636

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)		Publication date
EP 320864	A	21-06-1989	DE	3743695 A	29-06-1989
			JP	2000224 A	05-01-1990
			US	4943310 A	24-07-1990
EP 186120	A	02-07-1986	AR	240909 A	27-03-1991
			AU	586845 B	27-07-1989
			AU	5133885 A	26-06-1986
			BR	8506423 A	02-09-1986
			CA	1314556 A	16-03-1993
			DD	247211 A	01-07-1987
			DE	3566397 A	29-12-1988
			DK	594685 A	21-06-1986
			FI	855048 A	21-06-1986
			GR	853111 A	22-04-1986
			JP	1986395 C	08-11-1995
			JP	7013034 B	15-02-1995
			JP	61155347 A	15-07-1986
			PT	81731 B	18-12-1987
			US	4806146 A	21-02-1989
			US	4946981 A	07-08-1990
EP 186119	A	02-07-1986	AU	588014 B	07-09-1989
			AU	5133785 A	26-06-1986
			BG	43853 A	15-08-1988
			BG	45043 A	15-03-1989
			BR	8506424 A	02-09-1986
			CA	1314557 A	16-03-1993
			DD	246991 A	24-06-1987
			DK	594785 A	21-06-1986
			FI	855049 A	21-06-1986
			GR	853112 A	22-04-1986
			JP	1979680 C	17-10-1995
			JP	7005541 B	25-01-1995
			JP	61152649 A	11-07-1986
			PT	81732 B	18-12-1987
EP 186118	A	02-07-1986	AR	240794 A	28-02-1991
			AU	585917 B	29-06-1989
			AU	5133685 A	26-06-1986
			BG	46454 A	15-12-1989
			BG	46452 A	15-12-1989
			BR	8506425 A	02-09-1986
			CA	1314558 A	16-03-1993
			CN	1015044 B	11-12-1991
			CN	1039799 A,B	21-02-1990
			CS	8509551 A	13-10-1989
			DD	247210 A	01-07-1987
			DK	594885 A	21-06-1986
			FI	855050 A,B	21-06-1986
			GR	853113 A	22-04-1986
			HR	940856 A	30-06-1996
			IE	58400 B	08-09-1993
			JP	1993733 C	22-11-1995
			JP	7023347 B	15-03-1995
			JP	61152642 A	11-07-1986
			PT	81733 B	01-07-1988
			SU	1715190 A	23-02-1992
			US	5006158 A	09-04-1991

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

Inte	Application No
PCT/EP 98/04636	

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)		Publication date
EP 186118	A	US	4946981 A	07-08-1990
EP 278742	A	17-08-1988	AU 607183 B AU 1145488 A AU 6691090 A BG 47342 A CS 8800839 A DD 282005 A DK 68088 A FI 880591 A JP 63203644 A OA 8714 A PT 86750 B US 5114461 A	28-02-1991 18-08-1988 27-06-1991 15-06-1990 13-06-1990 29-08-1990 12-08-1988 12-08-1988 23-08-1988 31-03-1989 30-04-1992 19-05-1992
US 4780127	A	25-10-1988	US 4797150 A US 4853028 A US 5006158 A US 4816066 A US 4822906 A US 4806146 A US 4946981 A AU 560068 B AU 1276883 A BG 38931 A BR 8301522 A CA 1217204 A CS 236789 B DD 209377 A DE 3382601 A DK 131783 A, B, EP 0090262 A GR 77167 A IE 59474 B JP 1461556 C JP 58180451 A JP 63007534 B PT 76418 B US 5006162 A US 5085688 A ZA 8302094 A AU 573256 B AU 3305284 A BG 43852 A BR 8404629 A CA 1258869 A CZ 8406961 A DD 233150 A DE 3474297 A DK 439484 A EP 0137963 A GR 80346 A HR 940888 A IE 57940 B JP 1030818 B JP 1548106 C JP 60087238 A PT 79209 B	10-01-1989 01-08-1989 09-04-1991 28-03-1989 18-04-1989 21-02-1989 07-08-1990 26-03-1987 29-09-1983 14-03-1986 06-12-1983 27-01-1987 15-05-1985 09-05-1984 10-09-1992 26-09-1983 05-10-1983 10-09-1984 09-03-1994 14-10-1988 21-10-1983 17-02-1988 13-11-1986 09-04-1991 04-02-1992 28-03-1984 02-06-1988 21-03-1985 15-08-1988 06-08-1985 29-08-1989 14-06-1995 19-02-1986 03-11-1988 17-03-1985 24-04-1985 17-01-1985 30-06-1997 19-05-1993 22-06-1989 09-03-1990 16-05-1985 22-08-1986

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

Inte onal Application No
PCT/EP 98/04636

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)		Publication date
US 4780127	A	SK SU	696184 A 1715189 A	04-06-1997 23-02-1992
US 4954165	A	04-09-1990	JP JP US	2000222 A 2739738 B 5094685 A
EP 317158	A	24-05-1989	US JP	4925965 A 2256643 A
WO 9100260	A	10-01-1991	AT CN DE DE DK EP KR LV RU US CA JP LT	119146 T 1048848 A,B 69017383 D 69017383 T 432275 T 0432275 A 9405913 B 10074 A,B 2060988 C 5228898 A 2035446 A 3255047 A 336 A,B
				15-03-1995 30-01-1991 06-04-1995 29-06-1995 31-07-1995 19-06-1991 24-06-1994 10-05-1994 27-05-1996 20-07-1993 05-01-1991 13-11-1991 25-08-1994

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP 98/04636

A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 6 C07D261/04 C07D307/58 A01N43/80 A01N43/08

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprustoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
IPK 6 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprustoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 96, no. 5, 31. Mai 1996 & JP 08 020554 A (HOKKO CHEM IND CO LTD), 23. Januar 1996 siehe Zusammenfassung ---	1-4, 9, 12
Y	EP 0 320 864 A (SCHERING AG) 21. Juni 1989 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche 1,3,4 ---	1-4, 9, 12
A	EP 0 186 120 A (STAUFFER CHEMICAL CO.) 2. Juli 1986 siehe Ansprüche 1,21,23,37 ---	1-4, 7, 9-12
A	EP 0 186 119 A (STAUFFER CHEMICAL CO.) 2. Juli 1986 siehe Ansprüche 1,16,17,19 ---	1-4, 7. 9-12
		-/-

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfindenscher Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfindenscher Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann nahelegend ist

"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

30. November 1998

15/12/1998

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P. B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel: (+31-70) 340-2040, Tx 31 651 epo nl.
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Hass, C

1

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Int. nationales Aktenzeichen

PCT/EP 98/04636

C (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENDE UNTERLAGEN

Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr Anspruch Nr
A	EP 0 186 118 A (STAUFFER CHEMICAL CO.) 2. Juli 1986 siehe Ansprüche 1,27,28,45 ----	1-4,7, 9-12
A	EP 0 278 742 A (MAY & BAKER LTD) 17. August 1988 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche 1,5-7 ----	1-4,7, 9-12
A	US 4 780 127 A (W. J. MICHAELY ET AL.) 25. Oktober 1988 siehe Ansprüche 1,20,38 ----	1-4,9-12
A	US 4 954 165 A (M. BABA ET AL.) 4. September 1990 siehe Ansprüche 1,4,5; Tabellen ----	1-4,9-12
A	EP 0 317 158 A (ICI AMERICAS INC) 24. Mai 1989 siehe Ansprüche 1,5,6 ----	1-4,9-12
A	WO 91 00260 A (NIPPON SODA CO., LTD.) 10. Januar 1991 siehe Ansprüche 1,3; Tabelle 1 -----	1-4,9,12

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 98/04636

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 320864	A	21-06-1989	DE 3743695 A JP 2000224 A US 4943310 A	29-06-1989 05-01-1990 24-07-1990
EP 186120	A	02-07-1986	AR 240909 A AU 586845 B AU 5133885 A BR 8506423 A CA 1314556 A DD 247211 A DE 3566397 A DK 594685 A FI 855048 A GR 853111 A JP 1986395 C JP 7013034 B JP 61155347 A PT 81731 B US 4806146 A US 4946981 A	27-03-1991 27-07-1989 26-06-1986 02-09-1986 16-03-1993 01-07-1987 29-12-1988 21-06-1986 21-06-1986 22-04-1986 08-11-1995 15-02-1995 15-07-1986 18-12-1987 21-02-1989 07-08-1990
EP 186119	A	02-07-1986	AU 588014 B AU 5133785 A BG 43853 A BG 45043 A BR 8506424 A CA 1314557 A DD 246991 A DK 594785 A FI 855049 A GR 853112 A JP 1979680 C JP 7005541 B JP 61152649 A PT 81732 B	07-09-1989 26-06-1986 15-08-1988 15-03-1989 02-09-1986 16-03-1993 24-06-1987 21-06-1986 21-06-1986 22-04-1986 17-10-1995 25-01-1995 11-07-1986 18-12-1987
EP 186118	A	02-07-1986	AR 240794 A AU 585917 B AU 5133685 A BG 46454 A BG 46452 A BR 8506425 A CA 1314558 A CN 1015044 B CN 1039799 A, B CS 8509551 A DD 247210 A DK 594885 A FI 855050 A, B GR 853113 A HR 940856 A IE 58400 B JP 1993733 C JP 7023347 B JP 61152642 A PT 81733 B SU 1715190 A US 5006158 A	28-02-1991 29-06-1989 26-06-1986 15-12-1989 15-12-1989 02-09-1986 16-03-1993 11-12-1991 21-02-1990 13-10-1989 01-07-1987 21-06-1986 21-06-1986 22-04-1986 30-06-1996 08-09-1993 22-11-1995 15-03-1995 11-07-1986 01-07-1988 23-02-1992 09-04-1991

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 98/04636

Im Recherchenbericht angetuhrtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 186118	A	US	4946981 A	07-08-1990
EP 278742	A	17-08-1988	AU 607183 B AU 1145488 A AU 6691090 A BG 47342 A CS 8800839 A DD 282005 A DK 68088 A FI 880591 A JP 63203644 A OA 8714 A PT 86750 B US 5114461 A	28-02-1991 18-08-1988 27-06-1991 15-06-1990 13-06-1990 29-08-1990 12-08-1988 12-08-1988 23-08-1988 31-03-1989 30-04-1992 19-05-1992
US 4780127	A	25-10-1988	US 4797150 A US 4853028 A US 5006158 A US 4816066 A US 4822906 A US 4806146 A US 4946981 A AU 560068 B AU 1276883 A BG 38931 A BR 8301522 A CA 1217204 A CS 236789 B DD 209377 A DE 3382601 A DK 131783 A, B, EP 0090262 A GR 77167 A IE 59474 B JP 1461556 C JP 58180451 A JP 63007534 B PT 76418 B US 5006162 A US 5085688 A ZA 8302094 A AU 573256 B AU 3305284 A BG 43852 A BR 8404629 A CA 1258869 A CZ 8406961 A DD 233150 A DE 3474297 A DK 439484 A EP 0137963 A GR 80346 A HR 940888 A IE 57940 B JP 1030818 B JP 1548106 C JP 60087238 A PT 79209 B	10-01-1989 01-08-1989 09-04-1991 28-03-1989 18-04-1989 21-02-1989 07-08-1990 26-03-1987 29-09-1983 14-03-1986 06-12-1983 27-01-1987 15-05-1985 09-05-1984 10-09-1992 26-09-1983 05-10-1983 10-09-1984 09-03-1994 14-10-1988 21-10-1983 17-02-1988 13-11-1986 09-04-1991 04-02-1992 28-03-1984 02-06-1988 21-03-1985 15-08-1988 06-08-1985 29-08-1989 14-06-1995 19-02-1986 03-11-1988 17-03-1985 24-04-1985 17-01-1985 30-06-1997 19-05-1993 22-06-1989 09-03-1990 16-05-1985 22-08-1986

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 98/04636

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
US 4780127 A		SK SU	696184 A 1715189 A	04-06-1997 23-02-1992
US 4954165 A	04-09-1990	JP JP US	2000222 A 2739738 B 5094685 A	05-01-1990 15-04-1998 10-03-1992
EP 317158 A	24-05-1989	US JP	4925965 A 2256643 A	15-05-1990 17-10-1990
WO 9100260 A	10-01-1991	AT CN DE DE DK EP KR LV RU US CA JP LT	119146 T 1048848 A,B 69017383 D 69017383 T 432275 T 0432275 A 9405913 B 10074 A,B 2060988 C 5228898 A 2035446 A 3255047 A 336 A,B	15-03-1995 30-01-1991 06-04-1995 29-06-1995 31-07-1995 19-06-1991 24-06-1994 10-05-1994 27-05-1996 20-07-1993 05-01-1991 13-11-1991 25-08-1994